# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/006004

International filing date: 23 March 2005 (23.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP

Number: 2004-084605

Filing date: 23 March 2004 (23.03.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 14 April 2005 (14.04.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in

compliance with Rule 17.1(a) or (b)



23.3.2005

# 日本国特許庁 JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日 Date of Application:

2004年 3月23日

出 願 番 号 Application Number:

特願2004-084605

[ST. 10/C]:

[JP2004-084605]

出 願 人
Applicant(s):

日産化学工業株式会社

特許庁長官 Commissioner, Japan Patent Office 2005年 2月 9日

)· ")



1/E

【書類名】 特許願 【整理番号】 4670000 【提出日】 平成16年 3月23日 【あて先】 特許庁長官 殿 【国際特許分類】 C07D311/00 【発明者】 【住所又は居所】 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 科学研究所内 生頼 一彦 【氏名】 【発明者】 千葉県船橋市坪井町722番地1 【住所又は居所】 科学研究所内 【氏名】 繁田 幸宏 【発明者】 【住所又は居所】 千葉県船橋市坪井町722番地1 科学研究所内 【氏名】 上杉 理 【発明者】 千葉県船橋市坪井町722番地1 【住所又は居所】 科学研究所内 【氏名】 岡田 匠 【発明者】 【住所又は居所】 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 【氏名】 松田 智行 【特許出願人】 【識別番号】 000003986 【氏名又は名称】 日産化学工業株式会社 【代表者】 藤本 修一郎 【電話番号】 047-465-1120

005212

21,000円

明細書 1

要約書 1

特許請求の範囲 1

物質 日産化学工業株式会社 物質 日産化学工業株式会社 物質 日産化学工業株式会社 物質

【手数料の表示】

【予納台帳番号】

【納付金額】

【提出物件の目録】 【物件名】

【物件名】

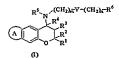
【物件名】

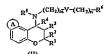
【書類名】特許請求の範囲

【請求項1】

式 (I) 又は (II)

【化1】





〔式中、 $R^1$  及び $R^2$  は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は $C_{6-1}$  4 アリール基(該アリール基は、ハロゲン原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)により任意に置換されていてもよい。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 $R^3$  は、水酸基若しくは $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は $R^4$  と一緒になって結合を意味し、

 $R^4$  は水素原子を意味するか、又は $R^3$  と一緒になって結合を意味し、

mは0~4の整数を意味し、

n は 0 ~ 4 の整数を意味し、

Vは単結合か、 $CR^7 R^8$   $(R^7 はC_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、$ 水酸基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロ アリール基は何れも q 個の $R^{1}$  0 0 はハロゲン原子、水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基( 該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はC1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロ ゲン原子で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)、Cı-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニ トロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、 アミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルカ ルボニルアミノ基、C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1</sub> - 6 アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak C}_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak C}_{1-6}$  アルキル カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $C_{1-6}$  アルキル スルホニル基、カルボキシル基又はC6 - 1 4 アリールカルボニル基である。) により任 意に置換されていてもよく、gは1~3の整数を表し、gが2又は3の場合、R¹゚は同 じでも異なっていてもよい。)、 $C_1 - 6$  アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シア ノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $5C_{1-6}$  ア ルキルアミノ基、C1 - 6 アルキルカルボニルアミノ基、C1 - 6 アルキルスルホニルアミ ノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1 - 6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジC<sub>1 - 6</sub> アルキルア ミノカルボニル基、 $C_1-6$  アルキルカルボニル基、 $C_1-6$  アルコキシカルボニル基、ア ミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホニル基で 任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-14}$  アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもg個の $R^{1}$ 0  $(R^{1}$ 0 及びgは、前記と同様の意 味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C1-6アルコキシ基( 該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニトロ基、シアノ基 、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、アミノ基、C1-6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C1 - 6 アルキルカルボニルアミノ基 、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカ ルボニル基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、C 1-6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、

カルボキシル基、 $C_{6-1}$  4 アリールカルボニル基又は $C_{2-9}$  ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れも q 個の $R^{1-0}$  ( $R^{1}$  の及び q は、前記と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 $R^8$  は水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、水酸基、 $C_{1-6}$ 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C 6-14 アリール基、C2-9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は 何れも o 個の $R^{1}$   $^{7}$   $(R^{1}$   $^{7}$   $tR^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表す。) により任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ 基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、C1-6アルキルアミノ基、ジC 1-6 アルキルアミノ基、C1-6 アルキルカルボニルアミノ基、C1-6 アルキルスルホ ニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1 - 6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジC<sub>1 - 6</sub> ア ルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニ ル基、アミノスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホ ニル基で任意に置換されていてもよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリー ル基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも o 個の $R^{17}$  ( $R^{17}$  は $R^{10}$  と同様の 意味を表し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水 酸基、С1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていても よい。)、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、ス ルホニル基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $icdot C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $icdot C_{1-6}$ 6 アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニ ル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $5C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、C1-6 アルキルカルボニル基、 $C_1-6$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - g ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニ ル基は何れも o 個の $R^{1}$   $^{7}$   $(R^{1}$   $^{7}$  は $R^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表 す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味するか或いはR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>が一緒に なって=0又は=Sを意味する。)、 $NR^9$  ( $R^9$  は水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、 $C_6 - 14$  アリール基、 $C_2 - 9$  ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れも o 個の $R^{1}$   $^{7}$   $(R^{1}$   $^{7}$  は $R^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表 し、oはgと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1-6ア ルキルアミノカルボニル基、ジ $C_1 - 6$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 - 6$  アルキルカ ルボニル基、 $C_3 - 8$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_1 - 6$  アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、 $C_{6-14}$  アリールカルボニル基又は $C_{2}$ - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub> アルキル アミノカルボニル基、ジC<sub>1 - 6</sub> アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1 - 6</sub> アルキルカルボニ ル基、 $C_3 - 8$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、C<sub>6-14</sub>アリールスルホニル基、C<sub>2-9</sub>ヘテロアリールスルホ ニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもo個のR<sup>17</sup>  $(R^{1/7} tR^{1/0} E )$  と同様の意味を表し、o t q E により任意に置換さ れていてもよい。)、カルボキシル基、C<sub>6-14</sub>アリールカルボニル基又はC<sub>2-9</sub>ヘテ ロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何 れも o 個の $\mathbb{R}^{1}$   $\mathbb{C}^{1}$   $\mathbb{C}^{1}$   $\mathbb{C}^{1}$   $\mathbb{C}^{1}$  と同様の意味を表し、 o は g と同様の意味を表す。)に より任意に置換されていてもよい。)を意味する。)、〇、S、SO又はSО2を意味し

 $R^5$  は、水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

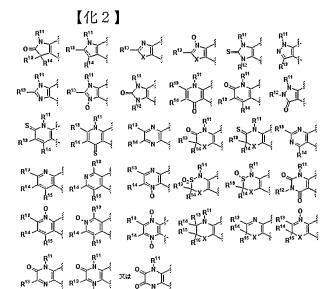
 $R^6$  は、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アル

コキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基 、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C3-8シクロアルキル 基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基は、ハロゲ ン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、C1-6アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C<sub>6-14</sub> アリールアミノ基、C<sub>2-9</sub> ヘテロアリールアミノ基 ( 該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れもp個のR¹8 (R¹8 はR¹0 と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。 )、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール 基は何れもp個の $R^{1\ 8}$ ( $R^{1\ 8}$ は $R^{1\ 0}$ と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す 。)により任意に置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシ クリル基は、ハロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ア ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C6-14 アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $\mathbb{R}^{1\ 8}$  ( $\mathbb{R}^{1\ 8}$  は $\mathbb{R}^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、 $\mathbb{P}$  は  $\mathbb{Q}$  と同様の意味を表す。) により任 意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミ ド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アル キルカルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C 1-6 アルキルアミノカルボニル基、 $5C_1-6$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_1-6$  ア ルキルカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C<sub>1-6</sub>ア ルキルスルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基で任意に置換 されていてもよい。)を意味し、

Aはベンゼン環と縮合する5、6又は7員環(該5、6又は7員環は何れも1個の $R^{2}$ 1  $(R^{2}$  は $R^{1}$  0 と同様の意味を表し、1は $1\sim6$  の整数を意味し、1が $2\sim6$  の場合、R2 1 は同じでも異なっていてもよい。)により任意に置換されていてもよく、環の構成原 子として酸素原子、窒素原子又は硫黄原子を1~3原子単独もしくは組み合わせて含むこ とができ、環内の不飽和結合の数は、縮合するベンゼン環の不飽和結合を含め、1、2又 は3であり、環を構成する炭素原子は、カルボニル又はチオカルボニルであってもよい。 )で表されるベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

【請求項2】

Αが、



(式中、 $R^{11}$ 及び $R^{12}$  はそれぞれ独立して、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、C<sub>6-14</sub> アリール基、C<sub>2-9</sub> ヘテロアリール基(該 アリール基及びへテロアリール基は何れもr個の $R^{19}$  ( $R^{19}$ は $R^{10}$ と同様の意味を表 し、rはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1-6ア ルキルアミノカルボニル基、 $5C_1 - 6$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 - 6$  アルキルカ ルボニル基、 $C_3 - 8$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_1 - 6$  アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C6 - 1 4 アリー ル基、 $C_{2}$  -  $_{9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも $_{r}$  個の $_{r}$   $_{0}$ <sup>9</sup> (R<sup>19</sup> はR<sup>10</sup> と同様の意味を表し、rはqと同様の意味を表す。) により任意に置換 されていてもよい。)、C1 - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC1 - 6 アルキルアミノ カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルカルボニル基、C1-6 アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、C6-14 アリールスル ホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロア リールスルホニル基は何れもr個の $R^{19}$  ( $R^{19}$ は $R^{10}$ と同様の意味を表し、rはqと 同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、C6-1 4 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基(該アリールカルボ ニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもr個の $R^{19}$  ( $R^{19}$  は $R^{10}$  と同様の意 味を表し、rはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)であり

 $R^{1\ 3}$  ,  $R^{1\ 4}$  ,  $R^{1\ 5}$  及び $R^{1\ 6}$  はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、水酸基、 $C_{6\ -1}$  4 アリール基、 $C_{2\ -9}$  へテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、s は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1\ -6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $5C_{1\ -6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{3\ -8}$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_{1\ -6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1\ -6}$  アルコキシルボニル基、カルボキシル基、 $C_{6\ -1}$  4 アリールカルボニル基又は $C_{2\ -9}$  ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1\ -6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 $C_{1\ -6}$  アルコキシ基(大阪水酸基、 $C_{6\ -1}$  4 アリール基又は $C_{2\ -9}$  ヘテロアリール基(該

アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{20}$  ( $R^{20}$  は $R^{10}$  と同様の意味を表 し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により任意に 置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  チオアルコキシ基(該チオアルコキシ基は、ハロゲ ン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、カルボキシル基、水酸基、C6-14アリール基又はC2-9ヘテロアリール 基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個の $R^{20}$ ( $R^{20}$ は $R^{10}$ と同様の意 味を表し、sはgと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により 任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリー ル基 (該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の 意味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C 1-6アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基 、アミノ基、スルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C 6-14 アリールアミノ基、C2-9 ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及び ヘテロアリールアミノ基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、 s は qと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキルカ ルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1-6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキル カルボニル基、C<sub>6-14</sub>アリールカルボニル基、C<sub>2-9</sub>ヘテロアリールカルボニル基( 該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもs個の $R^{2}$ 0 ( $R^{2}$ 0 は  $R^{1}$  と同様の意味を表し、S は G と同様の意味を表す。)により任意に置換されていて もよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $C_{1-6}$  アルキルス ルホニル基、C6-14アリールスルホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該 アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもs個の $R^{20}$ ( $R^{20}$ はR<sup>10</sup>と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。) により任意に置換されていても よい。)、カルボキシル基、スルホニル基又はC2-9へテロシクリル基(該へテロシク リル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミ ノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキ シ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>6</sub> − 1 4 ア リール基、C2-9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個  $OR^{20}$  ( $R^{20}$  は $R^{10}$  と同様の意味を表し、S は Q と同様の意味を表す。) により任意 に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド 基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキ ルカルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1</sub> - 6 アルキルアミノカルボニル基、ジC<sub>1</sub> - 6 アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1</sub> - 6 アル キルカルボニル基、 $C_1 - 6$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $C_1 - 6$  アル キルスルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基で任意に置換さ れていてもよい。)であり、

XはO, S, SO又はSO2を意味する。) である請求項1記載のベンゾビラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項3】

 $R^1$  及び $R^2$  が共にメチルであり、 $R^3$  が水酸基であり、 $R^4$  が水素原子である請求項2記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項4】

 $R^5$  が水素原子であり、mが0~3の整数であり、nが0~2の整数である、請求項3記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項5】

Vが単結合である、請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項6】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-14}$ アリール基(該アリール基は

p個の $R^{1\ 8}$  ( $R^{1\ 8}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、pは qと同様の意味を表す。) により 任意に置換されていてもよい。)である、請求項5記載のベンゾピラン誘導体又はその医 薬的に許容される塩。

# 【請求項7】

mが2である、請求項6記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項8】

R<sup>6</sup> がC<sub>6-14</sub> アリール基(該アリール基は p 個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に 置換されていてもよく、pは1~3の整数を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じで も異なっていてもよい。) である、請求項7記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に 許容される塩。

# 【請求項9】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_2-9$ へテロアリール基(該ヘテロア リール基は何れも p 個の $R^{1\ 8}$  ( $R^{1\ 8}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、 p は q と同様の意味 を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である、請求項5記載のベンゾピラン 誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項10】

mが2である、請求項9記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項11】

R<sup>6</sup> が2-ピリジル、3-ピリジル又は4-ピリジルである請求項10記載のベンゾピラ ン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項12】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_2-4$ アルキル基(該アルキル基はハ ロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基 (該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボ キシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコキシ基(該アル コキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C₃-sシクロアルキル基、C₃-sシク ロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C1-6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基は ハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基 で任意に置換されていてもよい。)、Cı- g アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン 原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に 置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基は、ハロ ゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基( 該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキ シル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、水酸基又はアミノ基で任意に 置換されていてもよい。)である請求項5記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許 容される塩。

#### 【請求項13】

mが2である請求項12記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項14】

 $\mathbb{R}^6$  が $\mathbf{n}$ -プロピル、 $\mathbf{i}$ -プロピル、 $\mathbf{c}$ -ペンチル、 $\mathbf{c}$ -ヘキシル、 $\mathbf{1}$ - $\mathbf{c}$ -ペンテニル、 $\mathbf{2}$ - $\mathbf{c}$ -ペンテ ニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニルである請求 項13記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項15】

Vが $CR^7R^8$ である請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

#### 【請求項16】

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基 出証特2005-3008820

(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $\Im C_{1-6}$  アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 $\mathbb{R}^8$  が水素原子又は $\mathbb{C}_{1-6}$  アルキル基(該アルコギン基はハロゲン原子、 $\mathbb{C}_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $\mathbb{R}^7$  及び $\mathbb{R}^8$  が一緒になって $\mathbb{E}$  である請求項 $\mathbb{E}$  15 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項17】

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=0である請求項 16 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項18】

 $\mathbb{R}^7$  が水酸基であり、  $\mathbb{R}^8$  が水素原子である請求項  $\mathbb{R}^7$  1 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項19】

 $mが1 \sim 2$  の整数であり、nが0であり、 $R^6$  が $C_{6-1}$  4 アリール基又は $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $R^{1-8}$  ( $R^{1-8}$  は $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である請求項 1 5 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項20】

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $\mathfrak{F}^{8}$  ジ $\mathfrak{F}^{1}$  ジ $\mathfrak{F}^{1}$  で任意に置換されていてもよい。)、 $\mathfrak{F}^{1}$  が水素原子又は $\mathfrak{F}^{1}$  でルキル基(該アルコキシ基はハロゲン原子、 $\mathfrak{F}^{1}$  では意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $\mathfrak{F}^{1}$  及び $\mathfrak{F}^{1}$  が一緒になって $\mathfrak{F}^{1}$  である請求項19記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項21】

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=0である請求項 20 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項22】

 ${\bf R}^7$  が水酸基であり、 ${\bf R}^8$  が水素原子である請求項 2 1 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項23】

mが1であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-14}$  アリール基(該アリール基は何れもp個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、pは $1\sim3$ の整数を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である請求項22記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項24】

mが  $1\sim 2$  の整数であり、nが0であり、R 6 が $C_{1-4}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。

)、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基、 $C_{3-8}$  シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルカルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は $C_{2-9}$  ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項15記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項25】

R  $^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 、 $C_{1-6}$  ジアルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルコギン基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=O又は=Sである請求項 2 4 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項26】

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が水素原子、又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=0である請求項25記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項27】

 $\mathbf{R}^7$  が水酸基であり、 $\mathbf{R}^8$  が水素原子である請求項  $\mathbf{2}^6$  記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項28】

 $R^6$  がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ペンチル、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、1-c-ペンチェル、1-c-ペナセニル、1-c-ペナセニル、1-c-ペナセニルである請求項27記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項29】

 $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=O又は=Sであり、 $R^6$  がアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{6-1}$  4 アリールアミノ基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個の $R^{1-8}$  ( $R^{1-6}$  と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)又は $C_{2-9}$  ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項 15 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項30】

Vが $NR^9$ である、請求項4記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項31】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-1}$ 4アリール基又は $C_{2-9}$ ヘテロ アリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp個の $R^{18}$  ( $R^{18}$  は $R^{10}$  と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。 )である請求項30記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項32】

mが2である請求項31記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項33】

mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が水素原子、 $C_2-4$ アルキル基(該アルキ ル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていて もよい。)、C3-8シクロアルキル基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル 基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲ ン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 C<sub>1-6</sub> アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。 )、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又はC2-9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該アル キル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい 。)である、請求項30記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項34】

mが2である請求項33記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項35】

式(I)である請求項3記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

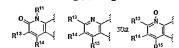
# 【請求項36】

式(II)である請求項3記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項37】

Aの環構造が

# 【化3】



(式中、 $\mathbf{R}^{1}$  、 $\mathbf{R}^{1}$  、 $\mathbf{R}^{1}$  及び $\mathbf{R}^{1}$  は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8、請求項11、請求項14、請求項23、請求項28又は請求項35記載のベンゾピラ ン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

# 【請求項38】

 $R^{1}$ が水素原子又は $C_{1-6}$ アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、R¹³、R¹⁴及びR¹⁵がそれぞ れ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原 子、アミノ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 С3-8 シクロアルキ ル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハ ロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されて いてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、アミノカ

ルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である請求項37記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項39】

 $R^{1-1}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  、 $R^{1-4}$  及び $R^{1-5}$  がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、アミノ基又はシアノ基である請求項 3 8 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

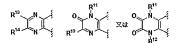
#### 【請求項40】

 $R^{1-1}$  が水素原子であり、 $R^{1-3}$  が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-4}$  が水素原子であり、 $R^{1-5}$  が水素原子、ハロゲン原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である請求項39記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項41】

Aの環構造が

【化4】



(式中、 $R^{1}$  1 、 $R^{1}$  2 、 $R^{1}$  3 及び $R^{1}$  4 は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8 、請求項 1 1 、請求項 1 4 、請求項 2 3 、請求項 2 8 又は請求項 3 5 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項42】

#### 【請求項43】

 $R^{1}$  及び $R^{1}$  2 がそれぞれ独立して水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1}$  3 及び $R^{1}$  4 がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である請求項42記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項44】

 $\mathbf{R}^{1}$   $\mathbf{1}$   $\mathbf{R}^{1}$   $\mathbf{2}$   $\mathbf{K}^{1}$   $\mathbf{3}$  及び $\mathbf{R}^{1}$  が共に水素原子である請求項  $\mathbf{4}$  3 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項45】

Aの環構造が

# 【化5】

(式中、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  及び $R^{1}$  は前記と同様の意味を表す。)である請求項8、請求項11、請求項14、請求項23、請求項28又は請求項35記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項46】

# 【請求項47】

 $R^{1-1}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  及び $R^{1-4}$  がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、XがOである請求項 4 6 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項48】

 $R^{1\ 1}$  が水素原子又は $C_{1\ -\ 6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 3}$  及び $R^{1\ 4}$  が共に水素原子であり、XがOである請求項47記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項49】

Aの環構造が

# 【化6】

(式中、 $R^{1}$  1 、 $R^{1}$  2 、 $R^{1}$  3 及び $R^{1}$  4 は前記と同様の意味を表す。)である請求項 8 、請求項 1 1 、請求項 1 4 、請求項 2 3 、請求項 2 8 又は請求項 3 5 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項50】

 で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である請求項49記載のベン ゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# 【請求項51】

 $R^{1}$  及び $R^{1}$  2 がそれぞれ独立して水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  及び $R^{1-4}$  が共に水素原子である請求項 5 0 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項52】

(2,2,7,9- テトラメチル-4-[(2- フェニルエチル) アミノ]-3,4- ジヒドロ-2H- ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエ チル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-7-カルボニトリル、3-ヒドロキ シ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボキサミド、{3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-「(2-フェニルエチル)ア [2, 3] [2, 3] [2, 3] [3, 4] [3, 4] [3, 4] [3, 4] [フェニルエチル)アミノ]-2.3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3.2-f]キノリン-2-オール、7-ヒドロ キシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[ 2.3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2.2.9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリ メチルー4-[2-(フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロー<math>2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボン酸、4-(ベンジルアミノ)-7クロロ-2, 2, 9-トリメ チルー3、4-ジヒドロー2H-ピラノ「2、3-g」キノリンー3-オール、7-クロロ  $-4-\{[2-(1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) メチル] アミノ<math>\{-2, 2, 9-1\}$ トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー2,2,9ートリメチルー4ー[(3-フェニルプロピル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-$ フルオロ フェニル)エチル]アミノ]ー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2 [3-g] + [2-(2-7)x + 3-x + 2x + 3-x + 3-y + 3アミノ-2, 2, 9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリ ートリメチルー3、4-ジヒドロー2H-ピラノ「2,3-g] キノリンー3-オール、4 $-\{[2-(4-r)] / (1-r)\}$ ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロー ル) アミノー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2,3-g]キノ )  $x \neq v$  ] [2, 2, 9 - 1] + [2, 3 - 2]g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4- $\{[2-(1-ピペリジ$ [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] = [2, 3-g] $-\nu$ 、7-200-2,2,9-トリメチル $-4-\{[2-(1-メチル-2-ピロリジニル)エチ$ [2, 3-g] キノリン-3-オール、4-[ 2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ $-4 - ({2 - [エチル(3 - メ)]})$ (5,0) チルフェニル)アミノ(1,0) エチル(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0) アミノ(1,0)H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4 $- \{ [(1-x+v-(R)-2-u^2)] + (1-x+v^2) + (1-x+v^2) \} = (1-x+v^2) + (1-x+v^2) +$ ノ[2,3-g] キノリンー3ーオール、7-2000-2,2,9ートリメチルー4ー[(2,2 -ジエトキシエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリンー3 ーオール、7 ークロロー2.2.9 ートリメチルー4 ー {[2-(3-チエニル)エチル]アミノ}

-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-4-[2-(1-ピラゾリルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチルー3, 4ージヒドロー2 Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3 -オール、7 - クロロー4 -  $\{[2-(4-1)]\}$ メチルピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ-2,2,9-トリメチルー3, 4ージヒ ークロロピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ}ー2,2,9ートリメチルー3, 4ージ ヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(2) --ピリジルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ ミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン -3-オール、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル) アミノ] -2,2,9-ト リメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -ク  $\Box\Box-4$  - エチルアミノー 2 , 2 , 9 - トリメチルー 3 , 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2 , 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソブチルアミノ-2,2,9-トリ メチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7-クロ -2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソアミルアミノ -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー4-[2-(シクロペンチルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメ チルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-4-[2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9 -トリメチルー4-[(1,4-ジメチルペンチル)アミノ]-3,4-ジヒドロー<math>2H-ピラノ[ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ) -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] -2,2,9ートリメチル<math>-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-2,2,9 -トリメチル-4-[(2-テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9ートリメチルー4- [(2-テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-イルエチル)アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-( + [6-(4-クロロフェニル)-3-ピリジニル] メチル アミノ) <math>-2,2,9-トリ メチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、4-[( 2 — ベンゾフラニルメチル) アミノ] -7-クロロ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒド ロキシペンチル) アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ- 2 + + ピラノ [2 , 3-g] キノリン-3-オール、7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミ ノ]-8,9-ジヒドロー7H-ピラノ[2,3-g]-キノキサリン-8-オール、 $\{[2-1]\}$ (2-7) (2ープルオフェニル) エチル]アミノ $\{-7, 7-5$  メチルー8, 9ージヒドロー7Hー ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、 $\{[2-(4-)7)$ オフェニル)エチル リン-8-オール、9-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-7, 7-ジ メチル-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール、7, 7-ジメチル 9-(ペンチルアミノ)-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2,3-g]-キノキサリン-8-オール、2,3,7,7-テトラメチル 9-[(2-フェニルエチル ) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール、2,3,-ジエチルー $7,\ 7-$ ジメチル 9-[(2-フェニルエチル)アミノ] $-8,\ 9-$ ジヒ ドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、3,7,7ートリメチルー 2-フェニルー9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8,9-ジヒドロー7Hーピラノ[ [(2-7x-1)(2サリン-8-オール、3, 7, 7-トリメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、9-[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[ 2, 3-g] - キノキサリン-8-オール、6, 7-イミダブリノ-3, 4-ジヒドロ-2, 2--ヒドロキシー6, 6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-4, 6, 7, 8-テトラヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセン-3-オン、7-ヒドロキシー 4, 6, 6-1-フェニルエチルアミノ) - 2, 3, 4, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロー 1, 5 - ジオキサ-4-アザーアントラセンー7-オール、7-ヒドロキシー6,6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-7,8-ジヒドロ-1H,6H-4,5-ジオキサ-1-アザ ーアントラセンー2ーオン、6,6ージメチルー8ー(2ーフェニルエチルアミノ)ー2, 3, 7, 8-テトラヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー 7- オール、9- ヒドロキシメチル-2, 2- ジメチル-4- [(2- フェニルエチル) アミノ] -3, 4- ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3,7-ジオール、7-アミノメチル-2,2,9 - トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3 -オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒ ドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-フルオロフェニル)エチ$ ル] アミノ} -2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g]キノリン-3-オー ル、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ)-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[ 2,3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-7-ヒドロキシメ チル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメ チル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ<math>-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール であるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

# 【請求項53】

2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ リン-3-オール、3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[ 3, 2-f] + J | y - 2 - x - y, 7 - E | y - 2 - x - y, 1 - 2 - x - y, 1 - 2 - x - y, 2 - x - yル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメ チル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[2-(フェニルエチル)アミノ]-34-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー7-カルボン酸、7-クロロー4ロー2Hーピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー4- $\{[2-(2-フルオ)]$ ロフェニル)エチル]アミノ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ  $r \in J - 2, 2, 9 -$ トリメチルー3, 4 -ジヒドロー2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリ ン-3-オール、 $4-\{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ\}-7-クロロ-2,2,9$ ートリメチルー3,4 ージヒドロー2 Hーピラノ[2, 3-g] キノリンー3 ーオール、7ークロロー4-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチルー 3. 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-2, 2,9-トリメチル-4-{[2-(1-ピペリジニル)エチル]アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - [2 - (4 -クロロ ピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ}-2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー 2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - [2 - (2 - ピリジ ルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(3-ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 -トリメチル-3, 4 -ジヒドロ-2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オ -ル、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル) アミノ] -2, 2, 9-トリメチル -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7-クロロ-4ーイソアミルアミノー2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2Hーピラノ[2,3g] キノリン-3 - オール、7 - クロロ-4 - [2 - (シクロペンチルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2 H-ピラノ [2,3-g] キノリンー3-オール、7-クロロー4-[2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] <math>-2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロロー2,2,9ートリメチルー4ー (ペンチルアミノ) -3, 4ージヒドロー2H-ピ ラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-シクロヘキシルエチ $(\mu)$  アミノ] (-2, 2, 9) ートリメチルー3, (4) -ジヒドロー2H - ピラノ [2, 3 - g] キ ノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシペンチル)アミノ]-2, 2, 9-トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H- ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール、7, 7-ジメチルー9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8,9-ジヒドロー7Hーピラノ[2, 3-g] - キノキサリン-8-オール、 $\{[2-(2-$ フルオフェニル) エチル] アミノ  $\{-7, 7-ジメチル8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-$ ジヒドロー 7Hーピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール、<math>9-[(2-ヒドロキ)]シー2-フェニルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ [2, 3-g] - キノキサリン- 8 - オール、7 , 7 - ジメチル 9 - (ペンチルアミノ) -8, 9ージヒドロー 7Hーピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー 8 ーオール、9ー[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]-7,7-ジメチル-8,9-ジヒドロ-7H-ピラノ[ 2, 3-g] - キノキサリン-8-オール、7-ヒドロキシ-6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)ー4,6,7,8ーテトラヒドロー1,5ージオキサー4ーアザ ーアントラセンー3ーオン、7ーヒドロキシー4,6,6ートリメチルー8ー(2ーフェニ ルエチルアミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアン トラセン-3-オン、7-ヒドロキシ-6,6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミ J)-7,8-ジヒドロー1H,6H-4,5-ジオキサー1ーアザーアントラセンー2 ーオン、9-ヒドロキシメチルー2,2-ジメチルー4-[(2-フェニルエチル)アミノ] -3, 4-ジヒドロ 2-H-ピラノ[2, 3-g]-キノリン-3-オール、2, 2, 9-トリメチ ル、7-アミノメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-2,2,9-トリメチル-5-オキシ3,4-ジヒドロ-2H-ピラ ノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ) -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチ  $\nu$ ]アミノ}-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ リン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラ ノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩

# 【請求項54】

請求項 $1\sim53$ のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする医薬。

#### 【請求項55】

請求項 $1\sim5$ 3のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする不整脈治療薬。

# 【書類名】明細書

【発明の名称】 3 環性ベンゾピラン化合物

# 【技術分野】

[0001]

本発明は、不応期延長作用を有するベンゾピラン誘導体に関するものであり、ヒトを含む哺乳動物に対する不整脈の治療に用いられるものである。

# 【背景技術】

# [0002]

ベンゾピラン誘導体としてはクロマカリムに代表される4-アシルアミノベンゾピラン誘導体が知られている(例えば、特許文献1参照。)。これらクロマカリムに代表される4-アシルアミノベンゾピラン誘導体はATP感受性K+チャンネルを開口し、高血圧や喘息の治療に有効であることが知られているが、不応期延長作用に基づく不整脈の治療に関しては言及されていない。

# [0003]

又、 $\beta$ 3 受容体作活性化作用を有し、肥満の治療に有効と考えられる4-アミノベンゾピラン誘導体が報告されている(例えば、特許文献2参照。)ものの、不応期延長作用に基づく不整脈の治療に関しては言及されていない。

【特許文献1】特開昭58-67683号公報

【特許文献2】国際公開第2003/014113号パンフレット

# 【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

# [0004]

ところで、不応期延長作用を主たる機序とする従来の抗不整脈薬(例えばVaughanWilliamsによる抗不整脈薬分類の1群薬や、3群に属するdーソタロール、ドフェチライドなど)は、不応期延長作用と関連のある心室筋活動電位の延長に基づくtorsadesde pointes等の突然死を誘発しうる極めて危険な不整脈誘発作用が治療上の課題になっており、より副作用の少ない薬剤が望まれている。

# 【課題を解決するための手段】

#### [0005]

本発明者らはこの課題を解決するために、心室筋よりも心房筋に選択的な不応期延長作用を有する化合物の探索研究を実施した結果、一般式(I)又は(II)で表される化合物に、心室筋の不応期および活動電位に影響することなく心房筋に選択的な不応期延長作用があることを見出し、本発明を完成させた。

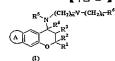
#### [0006]

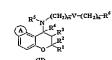
即ち、本発明は、

1. 式(I)又は(II)

[0007]

【化1】





#### [0008]

[式中、 $R^1$  及び $R^2$  は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基により任意に置換されていてもよい。)又は $C_{6-1}$  4 アリール基(該アリール基は、ハロゲン原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)により任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 $R^3$  は、水酸基若しくは $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は $R^4$  と一緒になって結合を意味し、

 $R^4$  は水素原子を意味するか、又は $R^3$  と一緒になって結合を意味し、

mは0~4の整数を意味し、

nは0~4の整数を意味し、

Vは単結合か、 $CR^7R^8(R^7 は C_{1-6} アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、$ 水酸基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロ アリール基は何れもq個の $R^{1}$ 0 ( $R^{1}$ 0 はハロゲン原子、水酸基、 $C_{1}$ -6 アルキル基( 該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はC1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロ ゲン原子で任意に置換されていてもよい。) で任意に置換されていてもよい。)、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニ トロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、 アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルカ ルボニルアミノ基、 $C_1$  -  $_6$  アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、 $C_1$  -  $_6$ アルキルアミノカルボニル基、ジ $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキル カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $C_{1-6}$  アルキル スルホニル基、カルボキシル基又はC6-14アリールカルボニル基である。) により任 意に置換されていてもよく、qは $1\sim3$ の整数を表し、qが2又は3の場合、 $R^{1}$  は同 じでも異なっていてもよい。)、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シア ノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 ${\mathfrak i} {\mathfrak C}_{1-6}$  ア ルキルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルアミ ノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノカルボニル基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルア ミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、ア ミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基又はスルホニル基で 任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-1}$ 4 アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもq個の $R^{10}$ ( $R^{10}$ 及びqは、前記と同様の意 味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C1-6アルコキシ基( 該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ニトロ基、シアノ基 、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、スルホニル基、アミノ基、C<sub>1</sub>-6 アルキルアミノ基、ジC1-6 アルキルアミノ基、C1-6 アルキルカルボニルアミノ基 、C<sub>1 - 6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1 - 6</sub> アルキルアミノカ ルボニル基、 $\mathrm{UC}_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $\mathrm{C}_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $\mathrm{C}$ 1 - 6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルスルホニル基、 カルボキシル基、C6-14アリールカルボニル基又はC2-9ヘテロアリールカルボニル 基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもq個の $R^{1\ 0}$ ( $R^1$ <sup>0</sup>及びqは、前記と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味

 $R^8$  は水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、水酸基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-14}$  アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもの個の $R^{17}$  ( $R^{17}$  は $R^{10}$  と同様の意味を表し、oは q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-14}$  アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもo個の $C_{17}$  ( $C_{17}$  は $C_{17}$  と同様の

意味を表し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水 酸基、С1-6アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていても よい。)、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、スルホニルアミノ基、ス ルホニル基、アミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1-</sub>  $_6$  アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1}$   $_{-6}$  アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニ ル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak i} C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、C $_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $_{C_{1-6}}$  アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、 $_{C}$ 1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基 (該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニ ル基は何れも o 個の $\mathbb{R}^{1}$   $^{7}$   $(\mathbb{R}^{1}$   $^{7}$  は $\mathbb{R}^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、 o は q と同様の意味を表 す。)により任意に置換されていてもよい。)を意味するか或いはR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>が一緒に なって=0又は=Sを意味する。)、 $NR^9$ ( $R^9$  は水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル 基は、ハロゲン原子、C₁ - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置 換されていてもよい。)、水酸基、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れもo個の $R^{1}$   $^{7}$   $(R^{1}$   $^{7}$   $tR^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表 し、oはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 ア ルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak i}{\mathfrak C}_1$  -  ${\mathfrak 6}$  アルキルアミノカルボニル基、 ${\mathfrak C}_1$  -  ${\mathfrak 6}$  アルキルカ ルボニル基、 $C_{3}$  –  $_{8}$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_{1}$  –  $_{6}$  アルコキシカルボニル基、C1-6 アルキルスルホニル基、カルボキシル基、C6-14 アリールカルボニル基又はC2 - 9 ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1</sub> - 6 アルキル アミノカルボニル基、ジ $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニ ル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{6-1}$ 4 アリールスルホニル基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリールスルホ ニル基(該アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもo個の $R^{1}$ 7  $(R^{1}$   $^{7}$   $はR^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、o は q と同様の意味を表す。)により任意に置換さ れていてもよい。)、カルボキシル基、 $C_{6-14}$  アリールカルボニル基又は $C_{2-9}$  ヘテ ロアリールカルボニル基(該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何 れも o 個の $\mathbb{R}^{1}$   $^{7}$   $(\mathbb{R}^{1}$   $^{7}$   $\mathbb{tR}^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、 o は q と同様の意味を表す。)に より任意に置換されていてもよい。)を意味する。)、〇、S、SO又はS〇2を意味し

 $R^5$  は、水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

 $R^6$  は、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アル コキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基 、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C3 - 8シクロアルキル 基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基は、ハロゲ ン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、C1 - 6 アルキルアミノ基、ジC1 - 6 アルキルアミノ基、C6 - 1 4 アリールアミノ基、C2 - 9 ヘテロアリールアミノ基( 該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れもp個の $R^{1\ 8}$  ( $R^{1\ 8}$  は $R^{1\ 0}$  と 同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。 )、 $C_{6-1}$ 4 アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール 基は何れもp個の $R^{1\ 8}$  ( $R^{1\ 8}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す 。) により任意に置換されていてもよい。) 又はC2 - 9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシ クリル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、ア ミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-1}$  4 アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも p 個の $R^{1-8}$  ( $R^{1-8}$  は $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、P は Q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、カルボキシル基又は $C_{6-1}$  4 アリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)を意味し、

【0009】 2. Aが、

[0010]

【化2】

[0011]

(式中、 $R^{11}$ 及び $R^{12}$  はそれぞれ独立して、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、水酸基、 $C_{6-1}$  4 アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも r 個の $R^{1-9}$  は $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、r は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $5C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、カルボキシル基、 $C_{6-1}$  4 アリールカルボニル基又は $C_{2-9}$  ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-1}$  4 アリール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも r 個の $R^{1-9}$  は $R^{1-9}$  は $R^{1-9}$  と同様の意味を表し、r は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $5C_{1-6}$  アルキルアミノ

 $R^{13}$ .  $R^{14}$ .  $R^{15}$  及び $R^{16}$  はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1$ - 6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ 基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、水酸基、C6 − 1 4 ア リール基、C2-9ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもs個  $OR^{20}$   $(R^{20}$   $tR^{10}$  と同様の意味を表し、s は q と同様の意味を表す。)により任意 に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、ジ $C_{1-6}$  アルキル アミノカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルカルボニル 基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、カルボキシル基、  $C_{6-1}$  4 アリールカルボニル基又は $C_{2-9}$  ヘテロアリールカルボニル基で任意に置換さ れていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、カル ボキシル基、アミノ基、水酸基、 $C_{6-1}$ 4 アリール基又は $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該 アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意味を表 し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により任意に 置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  チオアルコキシ基(該チオアルコキシ基は、ハロゲ ン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。)、カルボキシル基、水酸基、C6-14アリール基又はC2-9ヘテロアリール 基 (該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の意 味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)により 任意に置換されていてもよい。)、水酸基、C6-14アリール基、C2-9ヘテロアリー ル基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2\ 0}$  ( $R^{2\ 0}$  は $R^{1\ 0}$  と同様の 意味を表し、sはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C 1-6 アルキルカルボニルオキシ基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基 、アミノ基、スルホニル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、C $_{6-1}$  4 アリールアミノ基、 $_{C_{2-9}}$  ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及び ヘテロアリールアミノ基は何れも s 個の $R^{2}$   $^{0}$  ( $R^{2}$   $^{0}$  は $R^{1}$   $^{0}$  と同様の意味を表し、 s は qと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキルカ ルボニルアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、アミノカルボニル基、C<sub>1-6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジC1-6アルキルアミノカルボニル基、C1-6アルキル カルボニル基、C6-14 アリールカルボニル基、C2-9 ヘテロアリールカルボニル基( 該アリールカルボニル基及びヘテロアリールカルボニル基は何れもs個の $R^{2\ 0}$ ( $R^{2\ 0}$ は R<sup>10</sup> と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。) により任意に置換されていて もよい。)、C1 - 6 アルコキシカルボニル基、アミノスルホニル基、C1 - 6 アルキルス ルホニル基、C6-14アリールスルホニル基、C2-9ヘテロアリールスルホニル基(該 アリールスルホニル基及びヘテロアリールスルホニル基は何れもs個の $R^{2}$ 0 ( $R^{2}$ 0 はR $^{1}$  0 と同様の意味を表し、 $_{\rm S}$  は  $_{\rm Q}$  と同様の意味を表す。)により任意に置換されていても よい。)、カルボキシル基、スルホニル基又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシク リル基は、ハロゲン原子、C1-6アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1-6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミ ノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキ シ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C6 − 1 4 ア

リール基、 $C_{2-9}$  ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも s 個の $R^{2-0}$  ( $R^{2-0}$  は $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、 s は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ホルミル基、ホルムアミド基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $S_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $S_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $S_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $S_{1-6}$  アルキルスルボニルアミノカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $S_{1-6}$  アルキルスルホニル基、カルボキシル基又は $S_{1-6}$  アリールカルボニル基で任意に置換されていてもよい。)であり、

# [0012]

3.  $R^1$  及び $R^2$  が共にメチルであり、 $R^3$  が水酸基であり、 $R^4$  が水素原子である 2. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# $[0\ 0\ 1\ 3]$

4.  $R^5$  が水素原子であり、mが0~3の整数であり、nが0~2の整数である、3. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0014]

5. Vが単結合である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

# [0015]

6.  $mが1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-14}$  アリール基(該アリール基は p 個の $R^{18}$  ( $R^{18}$  は $R^{10}$  と同様の意味を表し、p は Q と同様の意味を表す。 ) により任意に置換されていてもよい。)である、S. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0016]

7. mが2である、6. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# $[0\ 0\ 1\ 7]$

8.  $R^6$  が $C_{6-14}$  アリール基(該アリール基は p 個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、p は $1\sim3$  の整数を表し、p が 2 又は 3 の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である、7. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0018]

9.  $mが1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_2$  – 9 ヘテロアリール基(該ヘテロアリール基は何れもp個の $R^{1~8}$ ( $R^{1~8}$  は $R^{1~0}$  と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である、5. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0019]

10. mが2である、9. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

# [0020]

11.  $R^6$  が 2-ピリジル、3-ピリジル又は 4-ピリジルである 10. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0021]

12. mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_2-4$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_1-6$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_1-6$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $R^6$  アルコキシ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $R^6$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $R^6$  アルコキシボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $R^6$  アルコキル基、 $R^6$  が  $R^6$  が R

3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子 、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又 は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基は ハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基 で任意に置換されていてもよい。) 又はC2 - 9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基 は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該アルキル基は、ハロゲン原子、C1 - 6 アルコ キシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、 カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基( 該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、水酸基又はアミノ基 で任意に置換されていてもよい。)である5. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的 に許容される塩。

# [0022]

13. mが2である12. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

#### [0023]

1 4.  $R^{6}$  がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ヘキシル、1-c-ペンテニル、 2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニル である13. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0024]

VがCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>である4.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容さ れる塩。

# [0025]

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルコキシ 基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキ ルアミノ基、ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、R<sup>8</sup>が水素原子又 は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。) であるか或いは R 7 及び R 8 が一緒になって= O又は=Sである15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0026]

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。)又はカルボキシル基であり、R®が 水素原子又はC<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシ ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いはR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>が一緒になって=O である16. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0027]

18. R<sup>7</sup> が水酸基であり、R<sup>8</sup> が水素原子である 17. 記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

# [0028]

19. mが1~2の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-14}$ アリール基又は $C_{2}$ -9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $R^{18}$  ( $R^{18}$  $dR^{10}$  と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されてい てもよい。)である15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0029]

20.  $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ

基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C1 - 6 アルキ ルアミノ基、 $\mathfrak{I}_{C1-6}$  アルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 $\mathbb{R}^8$  が水素原子又 は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $\mathbb{R}^7$  及び $\mathbb{R}^8$  が一緒になって= O又は=Sである19. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0030]

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 21. はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。) 又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が 水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又はカルボキシ ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $\mathbb{R}^7$ 及び $\mathbb{R}^8$ が一緒になって $\mathbb{R}^8$ である20. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0031]

22. R  $^7$  が水酸基であり、R  $^8$  が水素原子である 21. 記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

# [0032]

2.3 . mが1であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-1.4}$ アリール基(該アリール基は何 れも p 個のハロゲン原子又はアミノ基で任意に置換されていてもよく、 p は 1 ~ 3 の整数 を表し、pが2又は3の場合、置換基は同じでも異なっていてもよい。)である22. 記 載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0033]

mが1~2の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{1-4}$ アルキル基(該アルキ ル基は、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。)、C3-8シクロアルキル基、C3-8シクロアルケニル基(該シクロアルキ ル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基はハロ ゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されてい てもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい 。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又はC2 - g ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルキル基(該ア ルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意 に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されて いてもよい。) C<sub>1-6</sub> アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換され ていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい 。) である15. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0034]

25.  $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  ア ルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ 基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ 基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルキ ルアミノ基、 $C_{1-6}$  ジアルキルアミノ基又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が水素原子又 はC<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いはR<sup>7</sup> 及びR<sup>8</sup> が一緒になって= O又は=Sである24. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0035]

 $R^7$  が水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基又 はカルボキシル基で任意に置換されていてもよい。) 又はカルボキシル基であり、 $R^8$  が 水素原子、又はC<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、水酸基、カルボキシ

ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いは $\mathbb{R}^7$  及び $\mathbb{R}^8$  が一緒になって $\mathbb{R}^8$  である  $\mathbb{R}^8$  2 5. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0036]

2.7.  $R^7$  が水酸基であり、 $R^8$  が水素原子である 2.6. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

#### [0037]

28.  $R^6$  がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ペキシル、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ペキセニル、2-c-ペキセニル又は3-c-ペキセニルである 27. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0038]

29.  $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=O又は=Sであり、 $R^6$  がアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個の $R^{1-8}$  ( $R^{1-8}$  は $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)又は $C_{2-9}$  ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(方の医薬的に許容される塩。

# [0039]

30. Vが $NR^9$  である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0040]

3 1. mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-1}$ 4 アリール基又は $C_{2}$  - 9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れもp 個の $R^{1-8}$  ( $R^{1-0}$  と同様の意味を表し、p は q と同様の意味を表す。)により任意に置換されていてもよい。)である 3 0. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0041]

32. mが2である31. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

# [0042]

33. mが $1\sim3$ の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が水素原子、 $C_2-4$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_1-6$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_3-8$  シクロアルキル基、 $C_3-8$  シクロアルケニル基(該シクロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、 $C_1-6$  アルコキシ基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_1-6$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_1-6$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は $C_2-9$  ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、 $C_1-6$  アルキル基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である、30. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

# [0043]

34. mが2である33. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0044]

式(I)である3.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0045]

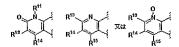
36. 式(II)である3.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0046]

37. Aの環構造が

[0047]

【化3】



[0048]

【0040】 (式中、 $R^{11}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 及び $R^{15}$ は前記と同様の意味を表す。) である 8. 、 11. 、14. 、23. 、28. 又は35. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的 に許容される塩。

[0049]

38.  $R^{1}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1}$ - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1\ 3}$ 、 $R^{1\ 4}$  及び $R^{1}$  $^{5}$  がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基は ハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意 に置換されていてもよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 、C3-8シ クロアルキル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコ キシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に 置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$ アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、ア ミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていて もよい。) 又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C1-6アルキルカルボニル 基、アミノカルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である37. 記載のべ ンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0050]

39. R<sup>11</sup> が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、ア ミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1/3}$ 、 $R^{1/4}$  及び $R^{1/5}$ がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル基はハロ ゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、ア ミノ基又はシアノ基である38. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0051]

40.  $R^{11}$  が水素原子であり、 $R^{13}$  が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基 又はC1-6アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置 換されていてもよい。)であり、 $R^{1/4}$ が水素原子であり、 $R^{1/5}$ が水素原子、ハロゲン 原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意 に置換されていてもよい。) である39. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許 容される塩。

[0052]

41. Aの環構造が

[0053]

ル基で任意に置換されていてもよい。)であるか或いはR<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>が一緒になって=O である25. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0036]

27. R<sup>7</sup> が水酸基であり、R<sup>8</sup> が水素原子である 26. 記載のベンゾピラン誘導体 又はその医薬的に許容される塩。

[0037]

 $R^6$  がn-プロピル、i-プロピル、c-ペンチル、c-ヘキシル、1-c-ペンテニル、 2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル又は3-c-ヘキセニル である27.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0038]

29.  $R^7$  及び $R^8$  が一緒になって=O又は=Sであり、 $R^6$  がアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、ジC<sub>1</sub> - 6 アルキルアミノ基、C<sub>6</sub> - 1 4 アリールアミノ基、C<sub>2</sub> - 9 ヘテロアリールアミノ基(該アリールアミノ基及びヘテロアリールアミノ基は何れも p 個 の $\mathbb{R}^{1\ 8}$  ( $\mathbb{R}^{1\ 8}$  は $\mathbb{R}^{1\ 0}$  と同様の意味を表し、 $\mathbb{P}$  は  $\mathbb{Q}$  と同様の意味を表す。)により任意 に置換されていてもよい。)又はC2-9ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロ ゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該 アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシ ル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキ シ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は 水酸基で任意に置換されていてもよい。)である15.記載のベンゾピラン誘導体又はそ の医薬的に許容される塩。

[0039]

30. VがNR<sup>9</sup>である、4. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され る塩。

[0040]

31. mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が $C_{6-14}$ アリール基又は $C_{2}$ - 9 ヘテロアリール基(該アリール基及びヘテロアリール基は何れも p 個のR<sup>18</sup> (R<sup>18</sup> はR<sup>10</sup>と同様の意味を表し、pはqと同様の意味を表す。)により任意に置換されてい てもよい。)である30.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0041]

32. mが2である31. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0042]

33. mが1~3の整数であり、nが0であり、 $R^6$ が水素原子、 $C_2-4$ アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子 で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換 されていてもよい。)、C3-8シクロアルキル基、C3-8シクロアルケニル基(該シク ロアルキル基及びシクロアルケニル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基(該アルキル 基はハロゲン原子、C1 - 6 アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換 されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていても よい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されてい てもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。) 又はC2-9 ヘテロシクリル基(該ヘテロシクリル基はハロゲン原子、C1-6 アルキル基 (該アルキル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子 で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換 されていてもよい。)、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に 置換されていてもよい。)、アミノ基、カルボキシル基又は水酸基で任意に置換されてい てもよい。) である、30. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0043]

mが2である33. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩 3 4.

[0044]

35. 式(I)である3.記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩

[0045]

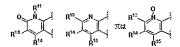
36. 式 (II) である 3. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される 塩。

[0046]

37. Aの環構造が

[0047]

【化3】



[0048]

(式中、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  及び $R^{1}$  は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 1 1. 、 1 4. 、 2 3. 、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0049]

38.  $R^{\frac{1}{1}}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{\frac{1}{3}}$  、 $R^{\frac{1}{4}}$  及び $R^{\frac{1}{5}}$  がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基(該シクロアルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アミノカルボニル基、アミノ基、カルボキシル基又はシアノ基である 37. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0050]

39.  $R^{\frac{1}{2}}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{\frac{1}{3}}$  、 $R^{\frac{1}{4}}$  及び $R^{\frac{1}{5}}$  がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、カルボキシル基、アミノ基又はシアノ基である38. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0051]

40.  $R^{1-1}$  が水素原子であり、 $R^{1-3}$  が水素原子、ハロゲン原子、カルボキシル基又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-4}$  が水素原子であり、 $R^{1-5}$  が水素原子、ハロゲン原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)である39. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0052]

41. Aの環構造が

[0053]

【化4】

[0054]

(式中、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  及び $R^{1}$  は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 11 、 14 、 23 、 28 . 又は 35 . 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0055]

42.  $R^{1-1}$  及び $R^{1-2}$  がそれぞれ独立して水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  及び $R^{1-4}$  がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基はハロゲン原子、F ミノ基、F と、F と、F と、F と、F に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、F と、F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と F と

[0056]

43.  $R^{1}$  及び $R^{1}$  2 がそれぞれ独立して水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1}$  3 及び $R^{1}$  4 がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である 42. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0057]

44.  $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び $R^{14}$  が共に水素原子である43. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0058]

45. Aの環構造が

[0059]

【化5】

[0060]

(式中、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  及び $R^{1}$  は前記と同様の意味を表す。)である 8. 、 1 1. 、 1 4. 、 2 3. 、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0061]

 のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0062]

47.  $R^{1-1}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  及び $R^{1-4}$  がそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、Xが〇である 46. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0063]

48.  $R^{1}$  が水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1}$  及び $R^{1}$  が共に水素原子であり、XがOである 47. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0064]

49. Aの環構造が

[0065]

【化6】

[0066]

(式中、 $R^{1}$  、 $R^{1}$  2、 $R^{1}$  3 及び $R^{1}$  4 は前記と同様の意味を表す。)である 8.、 1 1.、 1 4.、 2 3.、 2 8. 又は 3 5. 記載のベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

[0067]

50.  $R^{1-1}$  及び $R^{1-2}$  がそれぞれ独立して水素原子又は $C_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{6-14}$  アリール基(該アリール基はハロゲン原子、水酸基又はアルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、 $R^{1-3}$  及び $R^{1-4}$  がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基(該アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、 $C_{1-6}$  アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基はハロゲン原子、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基はハロゲン原子で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)、アミノ基又はシアノ基である49. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0068]

51. R $^{11}$  及びR $^{12}$  がそれぞれ独立して水素原子又はC $_{1-6}$  アルキル基(該アルキル基はハロゲン原子、アミノ基又は水酸基で任意に置換されていてもよい。)であり、R $^{13}$  及びR $^{14}$  が共に水素原子である 50. 記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容される塩。

[0069]

 ヒドロキシメチル-2.2.9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチルー4-[2]- (フェニルエチル) アミノ]-3, 4 -ジヒドロ-2 H -ピラノ[2, 3 - g]キノリン - 7-カルボン酸、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-(ベンジルアミノ)-7クロロ-2,2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、  $7-クロロ-4-\{[2-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)メチル]アミノ}ー$ 2, 2, 9 -トリメチル-3, 4 -ジヒドロ-2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オ ール、7-クロロー2,2,9-トリメチルー4-[(3-フェニルプロピル)アミノ]-3,4-フルオロフェニル)エチル]アミノ-2,2,9ートリメチルー3,4ージヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(2-$ フルオロフェニ  $\nu$ )エチル]アミノ $\{-2,2,9-$ トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3g] キノリンー3-オール、7-クロロ-4-  $\{[2-(4-$ クロロフェニル)エチル]アミノ $\}$ -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、 $4-\{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ\}-7-クロロー2,2,9ートリメ$ チルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロロ -4-[(2-ヒドロキシー2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - (2-フ ェニルブチル) アミノー 2, 2, 9 ートリメチルー 3, 4 ージヒドロー 2 H ーピラノ [2, 3] -g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(1, 3-ベンゾジオキソール$ -5-4ル) エチル] アミノ|-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラ ノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-{[2-(1)]-ピペリジニル)エチル]アミノ $\}$ -3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリ ジニル)エチル]アミノ $\}-3$ , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、4-[(2-rリニノエチル)rミノ]-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7-クロロ-4-( $\{2-$ [ エチル(3-メチルフェニル)アミノ]エチル アミノ) -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-ト リメチルー $4-\{[(1-x+v-(R)-2-ピロリジニル)メチル]アミノ\}-3,4-ジヒドロ$ -2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチ  $\nu - 4 - [(2, 2- i x +$ g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4- $\{[2$ -(3-チエニル) エチル]アミノ $\}-3$ , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール 、7-クロロー4-[2-(1-ピラゾリルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- $\{[2-(4-x+n)^2-(1-x+n)^2-$ 3. 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(2-3)] (2-3) [2-(2-3)] (2-3) [2-(2-3)] (2-3) [2-(2-3)] (3-3) [2-(2-3)] (3-3) [2-(2-3)] (3-3) [2-(2-3)] (3-3) [2-(2-3)] (4-ジヒドロー2) H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(3-ピリジル エチル) アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- [2- (4-ピリジルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オー ル、7-クロロ-4-エチルアミノ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-イソブチルアミノ<math>-2, 2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、 7-クロロ-4-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-2,2,9ートリメチルー3,4-

ジヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロー4-イソアミ ルアミノー 2, 2, 9 ートリメチルー 3, 4 ージヒドロー 2 H ーピラノ [2, 3-g] キノリ ン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(シクロペンチルエチル) アミノ] -2,2,9 ートリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロロー4ー [2-(1-シクロペンテニルエチル) アミノ] <math>-2,2,9ートリメチル -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、<math>7-クロロ-2, 2 , 9 -トリメチル-4-[(1, 4-ジメチルペンチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール、7-クロロー4-[(2-シクロヘキシルエチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4- [ (2-テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルエチル) アミノ ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロー 2, 2, 9 -トリメチル-4 - [(2-テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-イルエチル)]アミノ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン<math>-3-オール、7-ク9ートリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、 4-[(2-ベンゾフラニルメチル) アミノ] -7-クロロー2,2,9-トリメチルー3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[( 2-ヒドロキシペンチル)アミノ]-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピ ラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7, 7-ジメチル<math>-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、 {[2-(2-フルオフェニル) エチル]アミノ ト 7, 7-ジメチルー8, 9-ジヒド ロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、 $\{[2-(4-7)]$ ル) エチル] アミノ $\}$  - 7, 7 - ジメチル - 8, 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[2, 3 - g] ーキノキサリンー8-オール、9-[(2-ヒドロキシー2-フェニルエチル)アミノ]ー 7, 7 - ジメチル-8, 9 - ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、7,7-ジメチル 9ー (ペンチルアミノ) -8,9-ジヒドロー7H-ピラノ[2 , 3-g]-キノキサリン-8-オール、2, 3, 7, 7-テトラメチル 9-[(2-フェ ニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、2,3,-ジエチルー7,7-ジメチル9-[(2-フェニルエチル)アミノ]ー 8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、3, 7, 7-トリメチルー2-フェニルー9-[(2-フェニルエチル)アミノ]-8,9-ジヒドロー 7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール、2, 7, 7-トリメチル-3-フ ェニル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3][-g] = [-f] = [(1, 1) アミノ] (1, 2) 9 (1, 2) (1, 3) (1、9-[(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] -7, 7-ジメチル-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、6,7-イミダゾリノー3,4-ジ ヒドロ-2, 2-ジメチル-4-(2 '-フェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピランー 3-オール、7-ヒドロキシー6, 6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-4,6, 7, 8-テトラヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン、7 -ヒドロキシー4, 6, 6-トリメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-4, 6, 7,8-テトラヒドロー1,5-ジオキサー4-アザーアントラセンー3-オン、6,6-ジ メチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセン-7-オール、7-ヒドロキシー6,6-ジメチ  $\nu-8-(2-フェニルエチルアミノ)-7$ , 8-ジヒドロ-1H, 6H-4, 5-ジオキサ(3, 7, 8-r)=1 (3, 7, 8-r)=1 (4, 6)=1 (4, 5)=1ントラセンー7ーオール、9-ヒドロキシメチル-2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)ア

ミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3,7-ジオール、7-アミノメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-2,2,9-トリメチル-5-オキシ3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペンチルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許容される塩。

#### [0070]

2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2 ,3-g]キノリン-3-オール、3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1 H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール、7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-4-  $\{[2-(4-$ フルオロフェニル)エチル]アミノ $\}-2$ , 2, 9-ト リメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-ク  $\Box\Box-4-\{[2-(2-フルオロフェニル)エチル]アミノ\}-2,2,9-トリメチル-3,4$ ージヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 - クロロ-4 - {[2-(4 ークロロフェニル)エチル]アミノ}−2,2,9−トリメチル−3, 4−ジヒドロ−2H− ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチルー4-[2-(フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボン酸、4-{[2-(4-アミノフェニル)エチル]アミノ}-7-クロロー 2, 2, 9 ートリメチルー3, 4 ージヒドロー2 Hーピラノ [2, 3-g] キノリンー3 ーオ -ル、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチル)アミノ]-2,2,9-トリ メチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール、7-クロ ロー2,2,9ートリメチルー4ー $\{[2-(1-ピペリジニル)エチル]$ アミノ $\}$ ー3,4ージヒ ドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - + [2-(4 ークロロピラゾールー1ーイル) エチル] アミノ - 2,2,9 - トリメチルー3, 4 ージ ヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4- [2-(2) --ピリジルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2+[2, 3-g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[2-(3-ピリジルエチル) ア ミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2  $\mathrm{H}$  - ピラノ [2, 3 - g] キノリン -3-オール、7-クロロ-4-[2-(4-ピリジルエチル) アミノ] -2, 2, 9-ト リメチル-3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール、7-ク ロロー4-イソアミルアミノー2,2,9-トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g]  $\pm J$   $\parallel J$  アミノ] -2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリ ン-3 - オール、7 - クロロ-4 - [2 - (1 - シクロペンテニルエチル) アミノ] - 2 , 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン- 3 - オー ル、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ)-3,4-ジヒドロー 2 H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 -オール、7 -クロロ-4 - [(2 - シクロへキ)]シルエチル) アミノ] -2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2,3] -g] キノリン-3-オール、7-クロロ-4-[(2-ヒドロキシペンチル)アミノ]-2, 2, 9 - トリメチル- 3, 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリン- 3 - オー ル、7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, <math>9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、 $\{[2-(2-$ フルオフェニル)エチ  $\nu$ ]アミノ} -7, 7-ジメチル8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサ

リン-8-オール、 $\{[2-(4-$ フルオフェニル) エチル] アミノ $\}$  - 7. 7 - ジメチル -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、<math>9-[(2, 3-g)]ーヒドロキシー2ーフェニルエチル)アミノ]ー7,7ージメチルー8,9ージヒドロー 7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、7, 7-ジメチル 9- (ペンチ ルアミノ) -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール、7H-ピラノ[2.3-g]ーキノキサリン-8-オール、7-ヒドロキシー6.6-ジメチ 2-フェニルエチルアミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサー4-ア ザーアントラセンー3ーオン、7ーヒドロキシー6,6ージメチルー8ー(2ーフェニルエ チルアミノ)-7、8-ジヒドロ-1H、6H-4、5-ジオキサ-1-アザーアントラ セン-2-オン、9-ヒドロキシメチル-2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル )アミノ]-3,4-ジヒドロ2─H-ピラノ[2,3-g]-キノリン-3-オール、2,2,9-トリメチル-4-[(2-7x-2)x+2]アミノ]-3,4-3ビドロ-2H-2プラノ[2,3-2]キノリン-3,7-ジオール、7-アミノメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジ ヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-[((2-) 2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロ ロ-4- {[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ}-2.2.9-トリメチル-5-オキシ3.4-ジヒド u-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、7-クロロ-2,2,9-トリメチル-5-オキシ4-(ペン チルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール、4-{[2-(4-フルオロフ ェニル)エチル]アミノ├-7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g]キノリン-3-オール又は2,2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒド ロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オールであるベンゾピラン誘導体或いはその医薬的に許 容される塩。

# [0071]

54.  $1. \sim 53.$  のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする医薬。

# [0072]

55. 1.  $\sim$  53. のいずれかに記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩を有効成分として含有することを特徴とする不整脈治療薬。 に関するものである。

#### [0073]

本発明化合物は、強い不応期延長作用を有し、不整脈治療薬として用いることができる

# 【発明を実施するための最良の形態】

# [0074]

次に、本発明化合物(I)又は(II)の各置換基を具体的に説明する。

# [0075]

なお、本明細書中「n」はノルマルを、「i」はイソを、「s」はセカンダリーを、「t」はターシャリーを、「c」はシクロを、「o」はオルトを、「m」はメタを、「p」はパラを意味し、「Ph」はフェニルを、「Py」はピリジルを、「Bn」はベンジルを、「Me」はメチルを、「Et」はエチルを、「Pr」はプロピルを、「Bu」はブチルを、「Pen」はペンチルを、「Hex」はヘキシルを意味する。

# [0076]

 $C_{2-4}$  アルキル基としては、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル及びt-ブチル等が挙げられる。

#### [0077]

 $C_{1-4}$  アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル及びt-ブチル等が挙げられる。

[0078]

 $C_{1-6}$  アルキル基としては、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、1-ペンチル、2-ペンチル、3-ペンチル、i-ペンチル、ネオペンチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-ヘキシル、2-ヘキシル、3-ヘキシル、1-メチル-1-ペンチル、1, 1, 1, 1, 1-トリメチル-1-プロピル、1, 1, 1, 1-トリメチル-1-ブチル等が挙げられる。

[0079]

好ましくは、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、n-ペンチル及びi-ペンチルが挙げられる。

[0080]

 $C_{3-8}$ シクロアルキル基としては、c-プロピル、c-ブチル、1-メチル-c-プロピル、2-メチル-c-プロピル、c-ペンチル、1-メチル-c-ブチル、2-メチル-c-ブチル、3-メチル-c-ブチル、1,2-ジメチル-c-プロピル、2-メチル-c-プロピル、2-メチル-c-プロピル、2-メチル-2-プロピル、2-エチル-2-プロピル、2-スチル-2-ペキシル、2-メチル-2-ペキシル、2-メチル-2-ペキシル、2-メチル-2-ペキシル、2-メチル-2-ペンチル、2-メチル-2-プロピル、2-メチル-2-プロピル、2-エチル-2-プロピル、2-エチル-2-プリピル、2-エチル-2-ブチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル、2-アチル-2-アチル、2-アリピル-2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリピル、2-アリン・2-アリピル、2-アリン・2-アリピル、2-アリン・2-

#### [0081]

好ましくは c-ペンチル及びc-ヘキシルが挙げられる。

 $C_{3-8}$ シクロアルケニル基としては、1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-メチル-2-c-ペンテニル、1-メチル-3-c-ペンテニル、2-メチル-1-c-ペンテニル、2-メチル-2-c-ペンテニル、2-メチル-3-c-ペンテニル、2-メチル-4-c-ペンテニル、2-メチル-5-c-ペンテニル、2-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチル-3-c-ペンテニル、3-メチル-4-c-ペンテニル、3-メチル-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-メチレン-5-c-ペンテニル、3-オール、3-

[0082]

好ましくは1-c-ペンテニル、2-c-ペンテニル、3-c-ペンテニル、1-c-ヘキセニル、2-c-ヘキセニル及び3-c-ヘキセニルが挙げられる。

[0083]

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる 。好ましくは、フッ素原子、塩素原子及び臭素原子が挙げられる。

[0084]

 $C_{1-6}$  アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、t-ブトキシ、t-ブトキシ、t-ブトキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベキシルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベンチルオキシ、t-ベーープロポキシ、t-ベンチルカキシ、t-ベーープロポキシ、t-ベーープロポキシ、t-ベーープロポキシ、t-ベーープロポキシをびt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーープロポキシをでt-ベーー

[0085]

好ましくは、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ及びi-プロポキシが挙げられる。

[0086]

 $C_{1-6}$  チオアルコキシ基としては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プ

ロピルチオ、c-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、t-ベンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオ、i-ペンチルチオやグi-ペンチルチオ等が挙げられる。

#### [0087]

 $C_1$  - 6 アルキルカルボニルオキシ基としては、メチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペンチルカルボニルオキシ、i-ペキシルカルボニルオキシ、i-ペキシルカルボニルオキシ、i-ペナシルカルボニルオキシ、i-ペナシーのカルボニルオキシ、i-メチルi-パンチルカルボニルオキシ、i-パンチルカルボニルオキシ、i-パンチルカルボニルオキシ、i-パンチルカルボニルオキシ、i-パンチルカルボニルオキシ及びi-ジメチルi-アブチルカルボニルオキシ等が挙げられる。

#### [0088]

好ましくは、メチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ及びt-ブチルカルボニルオキシが挙げられる。

#### [0089]

 $C_{6-14}$  アリール基としては、フェニル、o-ビフェニリル、m-ビフェニリル、p-ビフェニリル、 $\alpha$ -ナフチル、 $\beta$ -ナフチル、1-アントリル、2-アントリル、9-アントリル、1-フェナントリル、2-フェナントリル、3-フェナントリル、4-フェナントリル及び9-フェナントリル等が挙げられる。

#### [0090]

好ましくは、フェニル、ο-ビフェニリル、m-ビフェニリル、p-ビフェニリル、α-ナフチル及びβ-ナフチルが挙げられる。

#### [0091]

 $C_{2-9}$ ヘテロアリール基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの $C_{2-6}$ 単環式複素環基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環基が含まれる。

#### [0092]

 $5\sim7$  員環までの $C_{2-6}$  単環式複素環基としては、2- チェニル基、3- チェニル基、2- フリル基、3- フリル基、2- ピラニル基、3- ピラニル基、4- ピラニル基、1- ピロリル基、2- ピロリル基、3- ピロリル基、1- イミダゾリル基、2- イミダゾリル基、2- イミダゾリル基、2- イミダゾリル基、2- イミダゾリル基、2- チアゾリル基、2- チアゾリル基、2- チアゾリル基、2- チアゾリル基、2- チアゾリル基、2- チアゾリル基、2- オキサゾリル基、2- オキサゾリル基、2- オキサゾリル基、2- オキサゾリル基、2- オキサゾリル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- ピリミジニル基、2- オーオキサジアゾリル基、2- アンブリル基、2- オーオキサジアブリル基、2- スティーオキサジアブリル基、2- スティーオキサジアブリル基、2- スティーオキサジアブリル基及び2- スティーオージアブリル基等が挙げられる。

#### [0093]

構成原子数が $8\sim1$ 0までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環基としては、2-ベンゾフラニル基、3-ベンゾフラニル基、4-ベンゾフラニル基、5-ベンゾフラニル基、6-ベンゾフラニル基、7-ベンゾフラニル基、1-イソベンゾフラニル基、4-イソベンゾフラニル基、1-インベンゾチエニル基、1-ベンゾチエニル基、1-ベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基、1-インベンゾチエニル基

、2-クロメニル基、3-クロメニル基、4-クロメニル基、5-クロメニル基、6-ク ロメニル基、7-クロメニル基、8-クロメニル基、1-インドリジニル基、2-インド リジニル基、3-インドリジニル基、5-インドリジニル基、6-インドリジニル基、7 -インドリジニル基、8-インドリジニル基、1-イソインドリル基、2-イソインドリ ル基、4-イソインドリル基、5-イソインドリル基、1-インドリル基、2-インドリ ル基、3-インドリル基、4-インドリル基、5-インドリル基、6-インドリル基、7 ーインドリル基、1ーインダゾリル基、2ーインダゾリル基、3ーインダゾリル基、4ー インダゾリル基、5-インダゾリル基、6-インダゾリル基、7-インダゾリル基、1-プリニル基、2-プリニル基、3-プリニル基、6-プリニル基、7-プリニル基、8-プリニル基、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7ーキノリル基、8ーキノリル基、1ーイソキノリル基、3ーイソキノリル 基、4-イソキノリル基、5-イソキノリル基、6-イソキノリル基、7-イソキノリル 基、8-イソキノリル基、1-フタラジニル基、5-フタラジニル基、6-フタラジニル 基、1-2、7-ナフチリジニル基、3-2,7-ナフチリジニル基、4-2,7-ナフチ リジニル基、1-2,6-ナフチリジニル基、3-2,6-ナフチリジニル基、4-2,6ーナフチリジニル基、2-1,8-ナフチリジニル基、3-1,8-ナフチリジニル基、4 -1.8-ナフチリジニル基、2-1,7-ナフチリジニル基、3-1,7-ナフチリジニ ル基、4-1,7-ナフチリジニル基、5-1,7-ナフチリジニル基、6-1,7-ナフ チリジニル基、8-1,7-ナフチリジニル基、2-1,6-ナフチリジニル基、3-1, 6-ナフチリジニル基、4-1,6-ナフチリジニル基、5-1,6-ナフチリジニル基、 7-1,6-ナフチリジニル基、8-1,6-ナフチリジニル基、2-1,5-ナフチリジ ニル基、3-1,5-ナフチリジニル基、4-1,5-ナフチリジニル基、6-1,5-ナ フチリジニル基、7-1,5-ナフチリジニル基、8-1,5-ナフチリジニル基、2-キ ノキサリニル基、5-キノキサリニル基、6-キノキサリニル基、2-キナゾリニル基、 4-キナゾリニル基、5-キナゾリニル基、6-キナゾリニル基、7-キナゾリニル基、 8-キナゾリニル基、3-シンノリニル基、4-シンノリニル基、5-シンノリニル基、 6-シンノリニル基、7-シンノリニル基、8-シンノリニル基、2-プテリジニル基、 4-プテリジニル基、6-プテリジニル基及び7-プテリジニル基等が挙げられる。

[0094]

好ましくは、2-ピリジル基、3-ピリジル及び基4-ピリジル基が挙げられる。

[0095]

 $C_{2-9}$ ヘテロシクリル基としては、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子の中から自由に選ばれる1つ以上の原子と2つ乃至9つの炭素原子からなる単環及び縮環二環性の複素環基が挙げられ、具体的には、

[0096]

【化7】

[0098]

 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基としては、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、c-プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、i-ブチルアミノ、c-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ベンチルアミクン・n-ベン

ミノ、1-ヘキシルアミノ、2-ヘキシルアミノ、3-ヘキシルアミノ、c-ヘキシルアミノ、1-メチル-n-ペンチルアミノ、1, 1, 2-トリメチル-n-プロピルアミノ及び3, 3-ジメチル-n-ブチルアミノ等が挙げられる。

#### [0099]

好ましくは、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ及びn-ブチルアミノが挙げられる。

#### [0100]

ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピ ルアミノ、ジ-i-プロピルアミノ、ジ-c-プロピルアミノ、ジ-n-ブチルアミノ、ジ-i-ブチ ルアミノ、ジ-s-ブチルアミノ、ジ-t-ブチルアミノ、ジ-c-ブチルアミノ、ジ-1-ペンチル アミノ、ジ-2-ペンチルアミノ、ジ-3-ペンチルアミノ、ジ-i-ペンチルアミノ、ジ-ネオペ ンチルアミノ、ジ-t-ペンチルアミノ、ジ-c-ペンチルアミノ、ジ-1-ヘキシルアミノ、ジ-2-ヘキシルアミノ、ジ-3-ヘキシルアミノ、ジ-c-ヘキシルアミノ、ジ-(1-メチル-n-ペン チル) アミノ、ジ-(1,1,2-トリメチル-n-プロピル) アミノ、ジ-(1,2,2-トリメチル-n-プロ ピル)アミノ、ジ-(3,3-ジメチル-n-ブチル)アミノ、メチル(エチル)アミノ、メチル(n-プ ロピル)アミノ、メチル(i-プロピル)アミノ、メチル(c-プロピル)アミノ、メチル(n-ブチ ル)アミノ、メチル(i-ブチル)アミノ、メチル(s-ブチル)アミノ、メチル(t-ブチル)アミ ノ、メチル(c-ブチル)アミノ、エチル(n-プロピル)アミノ、エチル(i-プロピル)アミノ、 エチル(c-プロピル)アミノ、エチル(n-ブチル)アミノ、エチル(i-ブチル)アミノ、エチル (s-ブチル)アミノ、エチル(t-ブチル)アミノ、エチル(c-ブチル)アミノ、n-プロピル(i-プロピル)アミノ、n-プロピル(c-プロピル)アミノ、n-プロピル(n-ブチル)アミノ、n-プ ロピル(i-ブチル)アミノ、n-プロピル(s-ブチル)アミノ、n-プロピル(t-ブチル)アミノ、 n-プロピル(c-ブチル)アミノ、i-プロピル(c-プロピル)アミノ、i-プロピル(n-ブチル)ア ミノ、i-プロピル(i-ブチル)アミノ、i-プロピル(s-ブチル)アミノ、i-プロピル(t-ブチ  $\nu$ )アミノ、i-プロピル(c-ブチル)アミノ、c-プロピル(n-ブチル)アミノ、c-プロピル(i-ブチル)アミノ、c-プロピル(s-ブチル)アミノ、c-プロピル(t-ブチル)アミノ、c-プロピ  $\nu$  (c-ブチル)アミノ、n-ブチル(i-ブチル)アミノ、n-ブチル(s-ブチル)アミノ、n-ブチル (t-ブチル)アミノ、n-ブチル(c-ブチル)アミノ、i-ブチル(s-ブチル)アミノ、i-ブチル(t--ブチル)アミノ、i-ブチル(c-ブチル)アミノ、s-ブチル(t-ブチル)アミノ、s-ブチル(c-ブチル)アミノ及びt-ブチル(c-ブチル)アミノ等が挙げられる。

#### $[0\ 1\ 0\ 1]$

「好ましくは、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジ-i-プロピルアミノ及びジ-n-ブチルアミノが挙げられる。

#### [0102]

 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基としては、メチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、n-プロピルカルボニルアミノ、i-プロピルカルボニルアミノ、n-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ブチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペンチルカルボニルアミノ、i-ペキシルカルボニルアミノ及びi-ペキシルカルボニルアミノ等が挙げられる。

#### [0103]

好ましくは、メチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、n-プロピルカルボニルアミノ、i-プロピルカルボニルアミノ及びn-ブチルカルボニルアミノが挙げられる。

#### [0104]

 $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、n-プロピルスルホニルアミノ、i-プロピルスルホニルアミノ、n-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ブチルスルホニルアミノ、i-ペンチルスルホニルア

ンチルスルホニルアミノ、1-ヘキシルスルホニルアミノ、2-ヘキシルスルホニルアミノ及び3-ヘキシルスルホニルアミノ等が挙げられる。

#### [0105]

好ましくは、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、n-プロピルスルホニルアミノ、i-プロピルスルホニルアミノ及びn-ブチルスルホニルアミノが挙げられる。

#### [0106]

 $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル基としては、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、i-プロピルアミノカルボニル、n-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ブチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベンチルアミノカルボニル、i-ベキシルアミノカルボニル、i-ベキシルアミノカルボニル及びi-ベキシルアミノカルボニル等が挙げられる。

#### [0 1 0 7]

好ましくは、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、i-プロピルアミノカルボニル及びn-ブチルアミノカルボニルが挙げられる。

#### [0108]

ジC1 - 6 アルキルアミノカルボニル基としては、ジメチルアミノカルボニル、ジエチ ルアミノカルボニル、ジ-n-プロピルアミノカルボニル、ジ-i-プロピルアミノカルボニル 、ジ-c-プロピルアミノカルボニル、ジ-n-ブチルアミノカルボニル、ジ-i-ブチルアミノ カルボニル、ジ-s-ブチルアミノカルボニル、ジ-t-ブチルアミノカルボニル、ジ-c-ブチ ルアミノカルボニル、ジ-1-ペンチルアミノカルボニル、ジ-2-ペンチルアミノカルボニル 、ジ-3-ペンチルアミノカルボニル、ジ-i-ペンチルアミノカルボニル、ジ-ネオペンチル アミノカルボニル、ジ-t-ペンチルアミノカルボニル、ジ-c-ペンチルアミノカルボニル、 ジ-1-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-2-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-3-ヘキシルアミ ノカルボニル、ジ-c-ヘキシルアミノカルボニル、ジ-(1-メチル-n-ペンチル)アミノカル ボニル、ジ-(1,1,2-トリメチル-n-プロピル) アミノカルボニル、ジ-(1,2,2-トリメチル-n-プロピル)アミノカルボニル、ジ-(3,3-ジメチル-n-ブチル)アミノカルボニル、メチル( エチル)アミノカルボニル、メチル(n-プロピル)アミノカルボニル、メチル(i-プロピル) アミノカルボニル、メチル(c-プロピル)アミノカルボニル、メチル(n-ブチル)アミノカル ボニル、メチル(i-ブチル)アミノカルボニル、メチル(s-ブチル)アミノカルボニル、メチ ル(t-ブチル)アミノカルボニル、メチル(c-ブチル)アミノカルボニル、エチル(n-プロピ ル)アミノカルボニル、エチル(i-プロピル)アミノカルボニル、エチル(c-プロピル)アミ ノカルボニル、エチル(n-ブチル)アミノカルボニル、エチル(i-ブチル)アミノカルボニル 、エチル(s-ブチル)アミノカルボニル、エチル(t-ブチル)アミノカルボニル、エチル(c-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(i-プロピル)アミノカルボニル、n-プロピル(c-プ ロピル)アミノカルボニル、n-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(i-ブチ ル)アミノカルボニル、n-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、n-プロピル(t-ブチル) アミノカルボニル、n-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(c-プロピル)ア ミノカルボニル、i-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(i-ブチル)アミノ カルボニル、i-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、i-プロピル(t-ブチル)アミノカル ボニル、i-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(n-ブチル)アミノカルボニ ル、c-プロピル(i-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(s-ブチル)アミノカルボニル、 c-プロピル(t-ブチル)アミノカルボニル、c-プロピル(c-ブチル)アミノカルボニル、n-ブ チル(i-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(s-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、n-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル、i-ブチル(s-ブチル) アミノカルボニル、i-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、i-ブチル(c-ブチル)アミノカ ルボニル、s-ブチル(t-ブチル)アミノカルボニル、s-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル 及びt-ブチル(c-ブチル)アミノカルボニル等が挙げられる。

[0109]

好ましくは、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジ-n-プロピルアミノカルボニル、ジ-i-プロピルアミノカルボニル、ジ-c-プロピルアミノカルボニル及びジ-n-ブチルアミノカルボニルが挙げられる。

### [0110]

 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基としては、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、i-ブチルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、t-ベンチルカルボニル、t-ベンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル、t-ペンチルカルボニル

#### [0111]

好ましくは、メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル及びn-ブチルカルボニルが挙げられる。

#### [0112]

C<sub>3-8</sub>シクロアルキルカルボニル基としては、c-プロピルカルボニル、c-ブチルカルボニ ル、1-メチル-c-プロピルカルボニル、2-メチル-c-プロピルカルボニル、c-ペンチルカル ボニル、1-メチル-c-ブチルカルボニル、2-メチル-c-ブチルカルボニル、3-メチル-c-ブ チルカルボニル、1,2-ジメチル-c-プロピルカルボニル、2,3-ジメチル-c-プロピルカルボ ニル、1-エチル-c-プロピルカルボニル、2-エチル-c-プロピルカルボニル、c-ヘキシルカ ルボニル、c-ヘプチルカルボニル、c-オクチルカルボニル、1-メチル-c-ヘキシルカルボ ニル、2-メチル-c-ヘキシルカルボニル、3-メチル-c-ヘキシルカルボニル、1,2-ジメチル -c-ヘキシルカルボニル、2,3-ジメチル-c-プロピルカルボニル、1-エチル-c-プロピルカ ルボニル、1-メチル-c-ペンチルカルボニル、2-メチル-c-ペンチルカルボニル、3-メチル -c-ペンチルカルボニル、1-エチル-c-ブチルカルボニル、2-エチル-c-ブチルカルボニル 、3-エチル-c-ブチルカルボニル、1,2-ジメチル-c-ブチルカルボニル、1,3-ジメチル-c-ブチルカルボニル、2,2-ジメチル-c-ブチルカルボニル、2,3-ジメチル-c-ブチルカルボニ ル、2,4-ジメチル-c-ブチルカルボニル、3,3-ジメチル-c-ブチルカルボニル、1-n-プロピ  $\nu_{-c-}$ プロピルカルボニル、2-n-プロピル-c-プロピルカルボニル、1-i-プロピル-c-プロ ピルカルボニル、2-i-プロピル-c-プロピルカルボニル、1,2,2-トリメチル-c-プロピルカ ルボニル、1,2,3-トリメチル-c-プロピルカルボニル、2,2,3-トリメチル-c-プロピルカル ボニル、1-エチル-2-メチル-c-プロピルカルボニル、2-エチル-1-メチル-c-プロピルカル ボニル、2-エチル-2-メチル-c-プロピルカルボニル及び2-エチル-3-メチル-c-プロピルカ ルボニル等が挙げられる。

#### [0113]

<u>-</u> 好ましくは c -ペンチルカルボニル及びc-ヘキシルカルボニルが挙げられる。

#### $[0\ 1\ 1\ 4]$

 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、i-プトキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、n-ベンチルオキシカルボニルをが挙げられる。

#### [0115]

好ましくは、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニルが挙げられる。

#### [0116]

C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル基としては、メタンスルホニル、トリフルオロメタンスルホニル及びエタンスルホニルが挙げられる。

[0117]

 $C_{6-14}$  アリールカルボニル基としては、フェニルカルボニル、O-ビフェニリルカルボニル、m-ビフェニリルカルボニル、p-ビフェニリルカルボニル、 $\alpha$ -ナフチルカルボニル、 $\beta$ -ナフチルカルボニル、1-アントリルカルボニル、2-アントリルカルボニル、9-アントリルカルボニル、1-フェナントリルカルボニル、2-フェナントリルカルボニル、3-フェナントリルカルボニル、4-フェナントリルカルボニル及び9-フェナントリルカルボニル等が挙げられる。

[0118]

好ましくは、フェニルカルボニル、ο-ビフェニリルカルボニル、m-ビフェニリルカルボニル、p-ビフェニリルカルボニル及び α-ナフチルカルボニル、β-ナフチルカルボニル等が挙げられる。

[0119]

 $C_{2-9}$ ヘテロアリールカルボニル基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$  員環までの $C_{2-6}$ 単環式複素環カルボニル基及び構成原子数が $8\sim1$  0 までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環カルボニル基が含まれる。

[0120]

 $5 \sim 7$  員環までの $C_{2-6}$  単環式複素環カルボニル基としては、2-チエニルカルボニル 基、3-チエニルカルボニル基、2-フリルカルボニル基、3-フリルカルボニル基、2 - ピラニルカルボニル基、3 - ピラニルカルボニル基、4 - ピラニルカルボニル基、1 -ピロリルカルボニル基、2-ピロリルカルボニル基、3-ピロリルカルボニル基、1-イ ミダゾリルカルボニル基、2-イミダゾリルカルボニル基、4-イミダゾリルカルボニル 基、1-ピラゾリルカルボニル基、3-ピラゾリルカルボニル基、4-ピラゾリルカルボ ニル基、2-チアゾリルカルボニル基、4-チアゾリルカルボニル基、5-チアゾリルカ ルボニル基、3-イソチアゾリルカルボニル基、4-イソチアゾリルカルボニル基、5-イソチアゾリルカルボニル基、2-オキサゾリルカルボニル基、4-オキサゾリルカルボ ニル基、5-オキサゾリルカルボニル基、3-イソオキサゾリルカルボニル基、4-イソ オキサゾリルカルボニル基、5-イソオキサゾリルカルボニル基、2-ピリジルカルボニ ル基、3-ピリジルカルボニル基、4-ピリジルカルボニル基、2-ピラジニルカルボニ ル基、2-ピリミジニルカルボニル基、4-ピリミジニルカルボニル基、5-ピリミジニ ルカルボニル基、3-ピリダジニルカルボニル基、4-ピリダジニルカルボニル基、2-1, 3, 4-オキサジアゾリルカルボニル基、2-1, 3, 4-チアジアゾリルカルボニ ル基、3-1,2,4-オキサジアゾリルカルボニル基、5-1,2,4-オキサジアゾ リルカルボニル基、3-1, 2, 4-チアジアゾリルカルボニル基、<math>5-1, 2, 4-チアジアゾリルカルボニル基、3-1, 2, 5-オキサジアゾリルカルボニル基及び3-1, 2, 5-チアジアゾリルカルボニル基等が挙げられる。

[0121]

構成原子数が8~10までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環カルボニル基としては、2-ベンゾフラニルカルボニル基、3-ベンゾフラニルカルボニル基、4-ベンゾフラニルカルボニル基、7-ベンゾフラニルカルボニル基、6-ベンゾフラニルカルボニル基、7-ベンゾフラニルカルボニル基、1-イソベンゾフラニルカルボニル基、1-イソベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾフラニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インベンゾチエニルカルボニル基、1-インバンゾチエニルカルボニル基、1-1ルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル基、1-1ルカルボニル

ジニルカルボニル基、8-インドリジニルカルボニル基、1-イソインドリルカルボニル 基、2-イソインドリルカルボニル基、4-イソインドリルカルボニル基、5-イソイン ドリルカルボニル基、1-インドリルカルボニル基、2-インドリルカルボニル基、3-インドリルカルボニル基、4ーインドリルカルボニル基、5ーインドリルカルボニル基、 6-インドリルカルボニル基、7-インドリルカルボニル基、1-インダゾリルカルボニ ル基、2-インダゾリルカルボニル基、3-インダゾリルカルボニル基、4-インダゾリ ルカルボニル基、5-インダゾリルカルボニル基、6-インダゾリルカルボニル基、7-インダゾリルカルボニル基、1-プリニルカルボニル基、2-プリニルカルボニル基、3 -プリニルカルボニル基、6-プリニルカルボニル基、7-プリニルカルボニル基、8-プリニルカルボニル基、2ーキノリルカルボニル基、3ーキノリルカルボニル基、4ーキ ノリルカルボニル基、5-キノリルカルボニル基、6-キノリルカルボニル基、7-キノ リルカルボニル基、8-キノリルカルボニル基、1-イソキノリルカルボニル基、3-イ ソキノリルカルボニル基、4-イソキノリルカルボニル基、5-イソキノリルカルボニル 基、6-イソキノリルカルボニル基、7-イソキノリルカルボニル基、8-イソキノリル カルボニル基、1-フタラジニルカルボニル基、5-フタラジニルカルボニル基、6-フ タラジニルカルボニル基、1-2、7-ナフチリジニルカルボニル基、3-2,7-ナフ チリジニルカルボニル基、4-2,7-ナフチリジニルカルボニル基、1-2,6-ナフチ リジニルカルボニル基、3-2,6-ナフチリジニルカルボニル基、4-2,6-ナフチリ ジニルカルボニル基、2-1,8-ナフチリジニルカルボニル基、3-1,8-ナフチリジ ニルカルボニル基、4-1,8-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,7-ナフチリジニ ルカルボニル基、3-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,7-ナフチリジニル カルボニル基、5-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、6-1,7-ナフチリジニルカ ルボニル基、8-1,7-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,6-ナフチリジニルカル ボニル基、3-1,6-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,6-ナフチリジニルカルボ ニル基、5-1,6-ナフチリジニルカルボニル基、7-1,6-ナフチリジニルカルボニ ル基、8-1,6-ナフチリジニルカルボニル基、2-1,5-ナフチリジニルカルボニル 基、3-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、4-1,5-ナフチリジニルカルボニル基 、6-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、7-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、 8-1,5-ナフチリジニルカルボニル基、2-キノキサリニルカルボニル基、5-キノ キサリニルカルボニル基、6-キノキサリニルカルボニル基、2-キナゾリニルカルボニ ル基、4-キナゾリニルカルボニル基、5-キナゾリニルカルボニル基、6-キナゾリニ ルカルボニル基、7-キナゾリニルカルボニル基、8-キナゾリニルカルボニル基、3-シンノリニルカルボニル基、4-シンノリニルカルボニル基、5-シンノリニルカルボニ ル基、6-シンノリニルカルボニル基、7-シンノリニルカルボニル基、8-シンノリニ ルカルボニル基、2-プテリジニルカルボニル基、4-プテリジニルカルボニル基、6-プテリジニルカルボニル基及び7-プテリジニルカルボニル基等が挙げられる。

#### $[0 \ 1 \ 2 \ 2]$

好ましくは、2-ピリジルカルボニル基、3-ピリジルカルボニル及び基4-ピリジルカルボニル基が挙げられる。

#### [0123]

 $C_{6-14}$  アリールスルホニル基としては、フェニルスルホニル、o-ビフェニリルスルホニル、m-ビフェニリルスルホニル、p-ビフェニリルスルホニル、 $\alpha$ -ナフチルスルホニル、 $\alpha$ -ナントリルスルホニル、 $\alpha$ -ナントリルスルホニル、 $\alpha$ -ナントリルスルホニル、 $\alpha$ -ナントリルスルホニル、 $\alpha$ -ナントリルスルホニル及び $\alpha$ -フェナントリルスルホニル等が挙げられる。

#### [0124]

好ましくは、フェニルスルホニル、o-ビフェニリルスルホニル、m-ビフェニリルスルホニル、p-ビフェニリルスルホニル及び α-ナフチルスルホニル、β-ナフチルスルホニル等が挙げられる。

[0125]

 $C_{2-9}$ ヘテロアリールスルホニル基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$ 員環までの $C_{2-6}$ 単環式複素環スルホニル基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環スルホニル基が含まれる。

#### [0126]

 $5 \sim 7$  員環までの $C_{2-6}$  単環式複素環スルホニル基としては、2- チエニルスルホニル 基、3-チエニルスルホニル基、2-フリルスルホニル基、3-フリルスルホニル基、2 - ピラニルスルホニル基、3 - ピラニルスルホニル基、4 - ピラニルスルホニル基、1 -ピロリルスルホニル基、2-ピロリルスルホニル基、3-ピロリルスルホニル基、1-イ ミダゾリルスルホニル基、2-イミダゾリルスルホニル基、4-イミダゾリルスルホニル 基、1-ピラゾリルスルホニル基、3-ピラゾリルスルホニル基、4-ピラゾリルスルホ ニル基、2-チアゾリルスルホニル基、4-チアゾリルスルホニル基、5-チアゾリルス ルホニル基、3-イソチアゾリルスルホニル基、4-イソチアゾリルスルホニル基、5-イソチアゾリルスルホニル基、2-オキサゾリルスルホニル基、4-オキサゾリルスルホ ニル基、5-オキサゾリルスルホニル基、3-イソオキサゾリルスルホニル基、4-イソ オキサゾリルスルホニル基、5-イソオキサゾリルスルホニル基、2-ピリジルスルホニ ル基、3-ピリジルスルホニル基、4-ピリジルスルホニル基、2-ピラジニルスルホニ ル基、2-ピリミジニルスルホニル基、4-ピリミジニルスルホニル基、5-ピリミジニ ルスルホニル基、3-ピリダジニルスルホニル基、4-ピリダジニルスルホニル基、2-1, 3, 4-オキサジアゾリルスルホニル基、2-1, 3, 4-チアジアゾリルスルホニ ル基、3-1,2,4-オキサジアゾリルスルホニル基、5-1,2,4-オキサジアゾ リルスルホニル基、3-1, 2, 4-チアジアゾリルスルホニル基、<math>5-1, 2, 4-チアジアゾリルスルホニル基、3-1,2,5-オキサジアゾリルスルホニル基及び3-1 . 2, 5-チアジアゾリルスルホニル基等が挙げられる。

#### [0127]

構成原子数が8~10までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環スルホニル基としては、2-ベン ゾフラニルスルホニル基、3-ベンゾフラニルスルホニル基、4-ベンゾフラニルスルホ ニル基、5-ベンゾフラニルスルホニル基、6-ベンゾフラニルスルホニル基、7-ベン ゾフラニルスルホニル基、1-イソベンゾフラニルスルホニル基、4-イソベンゾフラニ ルスルホニル基、5-イソベンゾフラニルスルホニル基、2-ベンゾチエニルスルホニル 基、3-ベンゾチエニルスルホニル基、4-ベンゾチエニルスルホニル基、5-ベンゾチ エニルスルホニル基、6-ベンゾチエニルスルホニル基、7-ベンゾチエニルスルホニル 基、1-イソベンゾチエニルスルホニル基、4-イソベンゾチエニルスルホニル基、5-イソベンゾチエニルスルホニル基、2-クロメニルスルホニル基、3-クロメニルスルホ ニル基、4-クロメニルスルホニル基、5-クロメニルスルホニル基、6-クロメニルス ルホニル基、7-クロメニルスルホニル基、8-クロメニルスルホニル基、1-インドリ ジニルスルホニル基、2ーインドリジニルスルホニル基、3ーインドリジニルスルホニル 基、5-インドリジニルスルホニル基、6-インドリジニルスルホニル基、7-インドリ ジニルスルホニル基、8-インドリジニルスルホニル基、1-イソインドリルスルホニル 基、2-イソインドリルスルホニル基、4-イソインドリルスルホニル基、5-イソイン ドリルスルホニル基、1-インドリルスルホニル基、2-インドリルスルホニル基、3-インドリルスルホニル基、4-インドリルスルホニル基、5-インドリルスルホニル基、 6-インドリルスルホニル基、7-インドリルスルホニル基、1-インダゾリルスルホニ ル基、2-インダゾリルスルホニル基、3-インダゾリルスルホニル基、4-インダゾリ ルスルホニル基、5-インダゾリルスルホニル基、6-インダゾリルスルホニル基、7-インダゾリルスルホニル基、1-プリニルスルホニル基、2-プリニルスルホニル基、3 ープリニルスルホニル基、6ープリニルスルホニル基、7ープリニルスルホニル基、8ー プリニルスルホニル基、2-キノリルスルホニル基、3-キノリルスルホニル基、4-キ ノリルスルホニル基、5-キノリルスルホニル基、6-キノリルスルホニル基、7-キノ

リルスルホニル基、8-キノリルスルホニル基、1-イソキノリルスルホニル基、3-イ ソキノリルスルホニル基、4-イソキノリルスルホニル基、5-イソキノリルスルホニル 基、6-イソキノリルスルホニル基、7-イソキノリルスルホニル基、8-イソキノリル スルホニル基、1-フタラジニルスルホニル基、5-フタラジニルスルホニル基、6-フ タラジニルスルホニル基、1-2、7-ナフチリジニルスルホニル基、3-2,7-ナフ チリジニルスルホニル基、4-2,7-ナフチリジニルスルホニル基、1-2,6-ナフチ リジニルスルホニル基、3-2,6-ナフチリジニルスルホニル基、4-2,6-ナフチリ ジニルスルホニル基、2-1,8-ナフチリジニルスルホニル基、3-1,8-ナフチリジ ニルスルホニル基、4-1,8-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,7-ナフチリジニ ルスルホニル基、3-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,7-ナフチリジニル スルホニル基、5-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、6-1,7-ナフチリジニルス ルホニル基、8-1,7-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,6-ナフチリジニルスル ホニル基、3-1.6-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,6-ナフチリジニルスルホ ニル基、5-1,6-ナフチリジニルスルホニル基、7-1,6-ナフチリジニルスルホニ ル基、8-1,6-ナフチリジニルスルホニル基、2-1,5-ナフチリジニルスルホニル 基、3-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、4-1,5-ナフチリジニルスルホニル基 、6-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、7-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、 8-1,5-ナフチリジニルスルホニル基、2-キノキサリニルスルホニル基、5-キノ キサリニルスルホニル基、6-キノキサリニルスルホニル基、2-キナゾリニルスルホニ ル基、4-キナゾリニルスルホニル基、5-キナゾリニルスルホニル基、6-キナゾリニ ルスルホニル基、7-キナゾリニルスルホニル基、8-キナゾリニルスルホニル基、3-シンノリニルスルホニル基、4-シンノリニルスルホニル基、5-シンノリニルスルホニ ル基、6-シンノリニルスルホニル基、7-シンノリニルスルホニル基、8-シンノリニ ルスルホニル基、2-プテリジニルスルホニル基、4-プテリジニルスルホニル基、6-プテリジニルスルホニル基及び7-プテリジニルスルホニル基等が挙げられる。

#### [0128]

好ましくは、2-ピリジルスルホニル基、3-ピリジルスルホニル及び基4-ピリジルスルホニル基が挙げられる。

#### [0129]

 $C_{6-1}$ 4 アリールアミノ基としては、フェニルアミノ、o-ビフェニリルアミノ、m-ビフェニリルアミノ、p-ビフェニリルアミノ、 $\alpha$ -ナフチルアミノ、 $\beta$ -ナフチルアミノ、1-アントリルアミノ、2-アントリルアミノ、3-アントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ、1-フェナントリルアミノ及び1-フェナントリルアミノ等が挙げられる。

#### [0130]

好ましくは、フェニルアミノ、o-ビフェニリルアミノ、m-ビフェニリルアミノ、p-ビフェニリルアミノ及び α-ナフチルアミノ、β-ナフチルアミノ等が挙げられる。

#### [0131]

 $C_{2-9}$ ヘテロアリールアミノ基としては、酸素原子、窒素原子、硫黄原子が $1\sim3$ 原子単独もしくは組み合わせて含むことができる $5\sim7$  員環までの $C_{2-6}$ 単環式複素環アミノ基及び構成原子数が $8\sim1$ 0までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環アミノ基が含まれる。

#### [0132]

 $5 \sim 7$  員環までの $C_{2-6}$  単環式複素環アミノ基としては、2-f エニルアミノ基、3-f チエニルアミノ基、2-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、2-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、1-f リルアミノ基、2-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、1-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、1-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、1-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f アゾリルアミノ基、3-f アゾリルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f リルアミノ基、3-f

リルアミノ基、3-4ソオキサゾリルアミノ基、4-4ソオキサゾリルアミノ基、5-4ソオキサゾリルアミノ基、2-2ピリジルアミノ基、3-2ピリジルアミノ基、4-2リジルアミノ基、2-2リジルアミノ基、2-2リミジニルアミノ基、2-2リミジニルアミノ基、2-2リダジニルアミノ基、2-2リダジニルアミノ基、2-1, 20、21、21、21、22、23、24 - オキサジアゾリルアミノ基、2-11、23、24 - オキサジアゾリルアミノ基、25 - 1、27、27 4 - オキサジアゾリルアミノ基、27 2、27 4 - オキサジアゾリルアミノ基、28 3 - 1、27 4 - チアジアゾリルアミノ基、28 3 - 1、27 5 - オキサジアゾリルアミノ基、28 5 - 1、27 5 - チアジアゾリルアミノ基、28 5 - 1、27 5 - チアジアゾリルアミノ基、28 5 - 1、27 5 - チアジアゾリルアミノ基等が挙げられる。

#### [0133]

構成原子数が8~10までの $C_{5-9}$ 縮合二環式複素環アミノ基としては、2-ベンゾフ ラニルアミノ基、3-ベンゾフラニルアミノ基、4-ベンゾフラニルアミノ基、5-ベン ゾフラニルアミノ基、6-ベンゾフラニルアミノ基、7-ベンゾフラニルアミノ基、1-イソベンゾフラニルアミノ基、4-イソベンゾフラニルアミノ基、5-イソベンゾフラニ ルアミノ基、2-ベンゾチエニルアミノ基、3-ベンゾチエニルアミノ基、4-ベンゾチ エニルアミノ基、5-ベンゾチエニルアミノ基、6-ベンゾチエニルアミノ基、7-ベン ゾチエニルアミノ基、1-イソベンゾチエニルアミノ基、4-イソベンゾチエニルアミノ 基、5-イソベンゾチエニルアミノ基、2-クロメニルアミノ基、3-クロメニルアミノ 基、4-クロメニルアミノ基、5-クロメニルアミノ基、6-クロメニルアミノ基、7-クロメニルアミノ基、8-クロメニルアミノ基、1-インドリジニルアミノ基、2-イン ドリジニルアミノ基、3-インドリジニルアミノ基、5-インドリジニルアミノ基、6-インドリジニルアミノ基、7-インドリジニルアミノ基、8-インドリジニルアミノ基、 1-イソインドリルアミノ基、2-イソインドリルアミノ基、4-イソインドリルアミノ 基、5-イソインドリルアミノ基、1-インドリルアミノ基、2-インドリルアミノ基、 3-インドリルアミノ基、4-インドリルアミノ基、5-インドリルアミノ基、6-イン ドリルアミノ基、7-インドリルアミノ基、1-インダゾリルアミノ基、2-インダゾリ ルアミノ基、3-インダゾリルアミノ基、4-インダゾリルアミノ基、5-インダゾリル アミノ基、6-インダゾリルアミノ基、7-インダゾリルアミノ基、1-プリニルアミノ 基、2-プリニルアミノ基、3-プリニルアミノ基、6-プリニルアミノ基、7-プリニ ルアミノ基、8-プリニルアミノ基、2-キノリルアミノ基、3-キノリルアミノ基、4 ーキノリルアミノ基、5ーキノリルアミノ基、6ーキノリルアミノ基、7ーキノリルアミ ノ基、8-キノリルアミノ基、1-イソキノリルアミノ基、3-イソキノリルアミノ基、 4-イソキノリルアミノ基、5-イソキノリルアミノ基、6-イソキノリルアミノ基、7 ーイソキノリルアミノ基、8-イソキノリルアミノ基、1-フタラジニルアミノ基、5-フタラジニルアミノ基、6-フタラジニルアミノ基、1-2、7-ナフチリジニルアミノ 基、3-2,7-ナフチリジニルアミノ基、4-2,7-ナフチリジニルアミノ基、1-2, 6 ーナフチリジニルアミノ基、3 ー 2 , 6 ーナフチリジニルアミノ基、4 ー 2 , 6 ーナフ チリジニルアミノ基、2-1,8-ナフチリジニルアミノ基、3-1,8-ナフチリジニル アミノ基、4-1,8-ナフチリジニルアミノ基、2-1,7-ナフチリジニルアミノ基、 3-1, 7-ナフチリジニルアミノ基、4-1, 7-ナフチリジニルアミノ基、5-1, 7ーナフチリジニルアミノ基、6-1,7-ナフチリジニルアミノ基、8-1,7-ナフチリ ジニルアミノ基、2-1,6-ナフチリジニルアミノ基、3-1,6-ナフチリジニルアミ ノ基、4-1,6-ナフチリジニルアミノ基、5-1,6-ナフチリジニルアミノ基、7-1,6-ナフチリジニルアミノ基、8-1,6-ナフチリジニルアミノ基、2-1,5-ナ フチリジニルアミノ基、3-1,5-ナフチリジニルアミノ基、4-1,5-ナフチリジニ ルアミノ基、6-1,5-ナフチリジニルアミノ基、7-1,5-ナフチリジニルアミノ基 、8-1,5-ナフチリジニルアミノ基、2-キノキサリニルアミノ基、5-キノキサリ ニルアミノ基、6-キノキサリニルアミノ基、2-キナゾリニルアミノ基、4-キナゾリ ニルアミノ基、5-キナゾリニルアミノ基、6-キナゾリニルアミノ基、7-キナゾリニ ルアミノ基、8-キナゾリニルアミノ基、3-シンノリニルアミノ基、4-シンノリニル アミノ基、5-シンノリニルアミノ基、<math>6-シンノリニルアミノ基、7-シンノリニルアミノ基、8-シンノリニルアミノ基、2-プテリジニルアミノ基、4-プテリジニルアミノ基、 <math>6-プテリジニルアミノ基及び7-プテリジニルアミノ基等が挙げられる。

[0134]

好ましくは、2-ピリジルアミノ基、3-ピリジルアミノ及び基4-ピリジルアミノ基が挙げられる。

[0135]

本発明に用いられる化合物の置換基の好ましい具体例について説明する。

[0136]

 $R^1$  及び $R^2$  の好ましい具体例としては、メチルが挙げられる。

[0137]

R<sup>3</sup> の好ましい具体例としては、水酸基が挙げられる。

[0138]

R<sup>4</sup> の好ましい具体例としては、水素原子が挙げられる。

[0139]

R<sup>5</sup> の好ましい具体例としては、水素原子が挙げられる。

[0140]

 $N-(CH_2)_m-V-(CH_2)_n-R^6$ の好ましい具体例としては、以下に示す1)~4)が挙げられる

[0156]

本発明に用いられる好ましい化合物としては、以下に示す化合物が挙げられる。

[0157]

(1)  $R^1$  及び $R^2$  が、共にメチル基であり、 $R^3$  が水酸基であり、 $R^4$  が水素原子である式 (I) 又は式 (II) で表されるベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容され得る塩

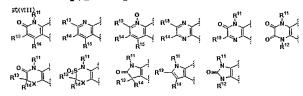
[0158]

(2) 式(I)である上記(1)記載のベンゾピラン誘導体又はその医薬的に許容さ 出証特2005-3008820 れ得る塩。

[0159]

- (3) Vが結合であり、mが1から3の整数であり、nが0又は1であり、 $R^6$ がベンゼン環である上記(2)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0160]
- (4) Vが $CR^7R^8(R^7$ は水産基、 $R^8$ は水素原子である。)であり、mが0又は1である上記 (3) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0161]
- (5)  $R^6$ がアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキニル基である上記(3)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0162]
- (6)  $VがCR^7R^8(R^7t)$  は水酸基、 $R^8t$  は水素原子である。)であり、mが0 又は1 である、上記(5)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0163]
- (7) Aが式 (VIII) である、上記 (3) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0164]

#### 【化18】



[0165]

- (8) Aが式(VIII)である、上記(4)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0166]
- (9) Aが式(VIII)である、上記(5)記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0167]
- (10) Aが式 (VIII) である、上記 (6) 記載のベンゾピラン誘導体またはその医薬的に許容される塩。
  - [0168]

以下に、本発明に用いることができる化合物の具体例を示すが、本発明はこれらに制限されるものではない。なお、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ac」はアセチル基( $COCH_3$ )を、「-」は結合をそれぞれ意味する。

[0169]

【表1】

HN −B			
HN - V	ни	ни~~О	HN N
HN	о́н С	HN \	
HN	HN F	HN	HN T
HN	HN		F HN N
$\overline{\cap}$	HN	HN	HN~N
HN	, MH	HN	HN~~S~
HN	HN F	···· }	HN O.
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN	HN
HN C		hN hH2	HN
ни		HŅ-We	HN N CI
	HN	HN	CN CN
HN OH	HN		HN
HN	HN N	N OH	

【0170】 【表2】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н	н	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	iPr	н	CHO	н	н	Н	CHO
H	н	nPr	н	SO₃H	н	н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	н	CI	Н	Н	Н	C1
H	Н	tBu	Н	Br	н	н	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	H	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	H	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	₽h	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Εt	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Εt	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	€t	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	íPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
₽h	Cl	Εŧ	Ph	SO <sub>3</sub> H	Εt	Ph	Εt	H
CH <sub>2</sub> OH	Cl	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	C1	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Ме	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH₂Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н
	7 0		, , <b>1</b>					

[0171]

【表3】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	н	Et	н	NO <sub>2</sub>	Н	Н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	н	SO₃H	Н	н	Н	so₃H
н	Н	nBu	Н	Cl	Н	н	н	CI
H	Н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Мe	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Εt	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ıPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	лВu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	H
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> CM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	иниs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	Н	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

# 【0172】 【表4】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н		н	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	ıPr	Н	CHO	Н		Н	Н	CHO
н	Н	n₽r	н	SO₃H	Н		H	Н	SO₃H
н	Н	nBu	H	Cl	Н		Н	Н	Cl
н	Н	tBu	Н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ρh	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	$NO_2$
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	₽h	Н
Ph	CI	Εt	Ph	so₃H	Et		Ph	Εt	H
CH <sub>2</sub> CH	CI	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	n₽r	Н
CH2OH	CI	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH₂OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		$CH_2NH_2$	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		$CH_2NH_2$	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph			Ph	н
CH₂NHMe	Ме	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	$NO_2$	Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH₂Ph	OH	Εt		CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	H	Н
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph_	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н

[0173]

【表5】

R <sup>11</sup>   R <sup>13</sup>   R <sup>14</sup>   R <sup>11</sup>   R <sup>13</sup>   R <sup>14</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>14</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>14</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>14</sup>   R <sup>15</sup>   R <sup>15</sup>										
H	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
H H IFF H CHO H H H CHO H H H IPF H SO3H H H H SO3H H H IPF H SO3H H H H CI H H IBU H CI H H H CI H H BBU H CH2OH H Me H CH2OH Me Et Ph Me CH3NH2 H Me H CH3NHM Me IPF H Me CH3NH2 H Me H CH2NHM Me IPF H Me CH3NH4 H Me H CH2NHM Me IPF H Me CH3NHM H Me H COME Me IBU H Me COME H Me H COME Et Ph H Et CONH4 Et Et Et CONHM Et H Et ET CONHM ET IPF ON IN IN INFO INFO INFO INFO INFO INFO	Н.	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н				
H H H nPr H SO <sub>3</sub> H H H H C C H H H H C C H H H H C C H H H H C C H H H H C C H C H C						Н				
H H H NBU H CI H H H H CI H H H H Br H CI H H H H Br H H CI H H H H Br H H CH2OH H Me H CH2OH H Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NHME ME IPT H ME CH2NHME H Me H CH2NHME ME NPT H ME CH2NHME H ME H CH2NHME ME NPT H ME COME H ME H COME ME IBU H ME COME H ME H COOH H ME TO ME H ME COOH H ME H COOH ME IBU H ME COOH ME IT ET ET CONHME ET ET ET CONHME ME H IPT NHOME NPT NHMS NPT NPT NPT NPT NHMS NPT			nPr		SO <sub>3</sub> H	Н				
H H tBu H Br H H H Br H H Br Me H CH₂OH H Me H CH₂OH H Me CH₂OH H Me H CH₂OHMe Me Et Ph Me CH₂OH H Me H CH₂NHMe Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NHMe Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H COMe Me IBu H Me COMe H Me H COMe Et Ph H Et CONHMe Et Et Et CONHME Et H Et Et CONHME Et H ET CONHMS IPr Et IPr CONHMS IPr IPr IPr NHMS IPr IPr IPr NHMS IPr IPr IPr NHMS IPr IPr IPR NHMS IPR		Н	nBu			Н				
Me         H         Ph         Me         CH₂OH         H         Me         H         CH₂OH           Me         Et         Ph         Me         CH₂NH₂         H         Me         H         CH₂NHMe         H         Me         H         COOH         COOH         H         H         COOH         COOH         L         L         L         COOH         L         L         L         COOH         Me         H         Me         H         COOH         Me         Me         H         COOH         Me         H         Me         H         Me         Me         H			tBu	н	Br	Н				
Me         Et         Ph         Me         CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H         Me         H         CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> NH           Me         nPr         H         Me         CH <sub>2</sub> NHMe         H         Me         H         CH <sub>2</sub> Ph         H         Me         H         COMe         H         COMe         H         H         COMe         H         COMe         H         COMe         H         COMe         H         COMe         H         COMe         H         Me         H         H         COMe         H         Me         H         Me         H <td></td> <td>н</td> <td>₽h</td> <td>Me</td> <td>CH<sub>2</sub>OH</td> <td>Н</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>		н	₽h	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н				
Me         IPr         H         Me         CH₂NHMe         H         Me         H CH₂NHMe           Me         nPr         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CCh₂Ph         H         Me         H         CCh₂Ph         H         Me         H         CCDMe         H         Me         H         CCOMe         H         ECOME         L         CCOMe         H         ECOME         L         CCOMe         H         CCOMe         CCOMe         H         CCOMe         CONHMS         IPr         EE         CCONHMS         IPr         LE         L         CONHMS         IPr         LE         L		Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н				
Me         nPr         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CC2Ph           Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COMe           Me         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         Ph         H         Et         CONHMS         Et         Et         H         CONHMS           Et         H         iPr         Et         CONHMS         iPr         Et         iPr         CONHMS           iPr         H         nPr         NHMS         nPr         iPr         nPr         NHMS           iPr         H         nPr         NHCOME         nBu         nPr         nPr         NHMS           nPr         H         nPr         1Pr         NHCOME         nBu         nPr         nPu         NHMS         NPC         nPu         nBu         NHMS         NPC         nPu         nPu         NHMS         NPC         nPu         nPu         NHMS         NPC         nPu         nPu         NHMS         NPC         NPC         NPC         NHMS         NPC		iPr	н	Me		Н		Me		
Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COMe           Me         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COOMe           Et         Ph         H         Et         COOHH         H         Et         H         COOHH           Et         Ph         H         Et         CONHME         Et         Et         Et         Et         Et         CONHME           Et         H         iir         Et         CONHME         Et         Et         Et         Et         CONHME         Et         Et         Et         Et         CONHME         Et         Et         Pr         CONHME         NO			н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н				
Me         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         Fh         H         Et         CONH2         H         Et         H         COOH4           Et         Fh         H         Et         Et         Et         Et         Et         CONHME           Et         H         iPr         Et         CONHME         Et         Et         iPr         CONHME           Et         H         iPr         Et         CONHMS         iPr         Et         iPr         CONHMS           iBPr         H         nPr         IPr         NHMS         nPr         iPr         nPr         NHMS         nPr         nPr         NHMS         NP         NHMS         NP         NHMS         NP         NP         NHMS         NP </td <td></td> <td></td> <td>н</td> <td>Me</td> <td>COMe</td> <td>Н</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>			н	Me	COMe	Н				
Et         Ph         H         Et         CONH-b         H         Et         H         CONH-b           Et         H         Et         Et         Et         CONH-b         Et         Et         CONH-b           Et         H         Et         Et         Et         CONH-b         Et         Et         CONH-b           Et         H         Et         CONH-b         Et         Et         CONH-b         R           Et         H         IPr         Et         CONH-b         IPr         IPr         NHM-S         NPr         IPr         NHM-S         NHM-S         NPr         IPr         NHM-S         NHCOME         IPR         NHCOME         NHM-S         NHCOME         IBU         NPC         NHM-S         NHCOME         IBU         NPC         NHM-S         NHCOME         NHCOME         NHCOME         IBU         NHCOME         NHCOME         NHCOME         NHCOME         NHCOME         NHCOME         LBU         NHCOME		tBu	н	Me	COOH	Н				
Et         H         Et         Et         CONHMe         Et         Et         Et         Et         CONHMS           Et         H         iiPr         Et         CONHMS         iiPr         Et         iiPr         CONHMS           iiPr         H         nPr         iiPr         NHMS         nPr         iiPr         nPr         NHMS           nPr         H         nBu         nPr         NHCOMe         nBu         nPr         nBu         NHCOMe           nBu         H         tBu         nBu         NO2         tBu         nBu         tBu         nPr         nBu         NHCOMe         NPc         NHCOME         NHCOME         NPc         nBu         NHCOME         NHCOME         NHCOME         nBu         nBu         NHCOME         NHCOME <td></td> <td></td> <td>н</td> <td>Et</td> <td>CONH<sub>2</sub></td> <td>н</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>			н	Et	CONH <sub>2</sub>	н				
Et         H         iPr         Et         CONHMS         iPr         Et         iPr         CONHMS           iPr         H         nPr         iPr         NHMS         nPr         iPr         nPr         H         H         H         H         PP         SO <sub>2</sub> NHMe         nPr         CH <sub>2</sub> OH         nPr         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         PP         CH <sub>2</sub> OH         PP         H         L         CH <sub>2</sub> OM         COM         COM         CI         CH <sub>2</sub> OM		Н	Et	Et	CONHMe	Et				
PF			iPr	Et	CONHMs	iPr				
nPr         H         nBu         nPr         NHCOMe         nBu         nPr         nBu NHCOMe           nBU         H         tBu         nPr         NHCOMe         nBu         nPr         nBu         NHCOMe           nBU         H         tBu         nBu         NDQ2         tBu         nBu         tBu         NHCOMe           tBu         H         Ph         tBu         CHO         Ph         tBu         tBu         NHCOMe           tBu         H         Ph         tBu         tBu<		Н	nPr	íPr	NHMs	nPr				
nBu         H         tBu         nBu         NO₂         tBu         nBu         tBu         NO₂           tBu         H         Ph         tBu         HBu         Ph         tBu         Ph         H         H         Ph         H         Bu         Ph         H         Bu         Ph         H         Bu         Ph         H         H         H         Ph         H         Ph         CD         Ph         CH₂OH         OND         Ph         CH₂OH         Ph         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         Ph         CH₂OMe         CI         CI         CH₂OMe         CI         CH₂OMe         CI         CH₂OMe         CI         CH₂OMe		н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu				
IBU         H         Ph         IBU         CHO         Ph         IBU         Ph         H         Ph           CH₂OH         Cl         Et         Ph         SO₂NHMe         Et         Ph         Et         H         H           CH₂OH         Cl         Ph         CH₂OH         OH         Ph         CH₂OH         Ph         H           CH₂OMe         Et         Cl         CH₂OMe         COMe         Cl         CH₂OMe         Cl         CH₂OMe         Cl         CH₂OMe         Cl         CH₂OMe         Cl         CH₂OMe         Cl         CH₂OMe         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl<		Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu				
Ph         Cl         Et         Ph         SO <sub>3</sub> H         Et         Ph         Et         H           CH <sub>2</sub> OH         Cl         nPr         CH <sub>2</sub> OH         SO <sub>2</sub> NHMe         nPr         CH <sub>2</sub> OH         nPr         H           CH <sub>2</sub> OH         Cl         Ph         CH <sub>2</sub> OH         OH         Ph         CH <sub>2</sub> OH         Ph         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         H         CH         COH         CI         CH <sub>2</sub> OMe         CI         CI         CI         CH <sub>2</sub> OMe         CI         C		Н	Ph	tBu	CHO	Ph				
CH₂OH         CI         nPr         CH₂OH         SO₂NHMe         nPr         CH₂OH         nPr         H           CH₂OH         CI         Ph         CH₂OH         Ph         CH₂OH         Ph         H           CH₂OMe         Et         CI         CH₂OMe         COMe         CI         CH₂OMe         CI         CI           CH₂OMe         nPr         CI         CH₂OMe         COOH         CI         CH₂OMe         CI         CI           CH₂NH₂         Ph         CI         CH₂NH₂         CONHW         CI         CH₂NH₂         Et         H           CH₂NH₂         H         Ph         CH₂NH₂         CONHMS         nPr         CH₂NH₂         nPr         H           CH₂NH₂         H         Ph         CH₂NH₂         NHMS         Ph         CH₂NH₂         Ph         H           CH₂NHM         Me         Me         CH₂NHM         NO₂         Me         CH₂NHM         Me         H           CH₂Ph         nPr         CH₂Ph         CH         Et         CH₂Ph         CH         Et         CH₂Ph         CH         Et         CH₂Ph         Ph         CH₂Ph         Ph         CH₂Ph         C		CI	Et	Ph	so₃H	Εt				
CH2OH CI Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph H CH2OH Ph H CH2OMe CI CI CH2OMe nPr CI CH2OMe COM CI CH2OMe CI CI CI CH2OME CI CI CI CH2OME CI CI CI CI CH2OME CI		CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr				
CH20Me         Et         CI         CH20Me         COMe         CI         CH20Me		CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH		
CH2OMe		Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI				
CH2NH2 Ph CI CH3NH2 CONH4 CI CH2NH2 CI CH2NH2 CI CH2NH2 CI CH2NH2 CNHM0 Et CH2NH2 Et H CH2NH2 H Ph CH2NH2 CONHMM NPT CH2NH2 NPT H CH2NH2 H Ph CH2NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph H CH2NHMM NO2 Me CH2NHMM ME H CH2Ph Et Et CH2Ph CH Et CH2Ph CH Et CH2Ph CH Et CH2Ph COME NPT CH2Ph H H CH2Ph NPT CH2Ph COME NPT CH2Ph H H	CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH					
CH2NH2         H         Et         CH2NH2         CONHMe         Et         CH2NH2         Et         H           CH3NH3         H         nPr         CH3NH3         nPr         CH2NH2         nPr         H           CH2NH4         H         Ph         CH2NH2         NMs         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NHME         Me         CH2NHME         NO2         Me         CH2NHME         Me         H           CH2Ph         Et         CH2Ph         OH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         nPr         CH2Ph         CH         H         H		Ph	CI		CONH <sub>2</sub>	CI				
CH2NH2         H         nPr         CH2NH2         CONHMS         nPr         CH2NH2         nPr         H           CH2NH2         H         Ph         CH2NH2         NHMS         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NHME         Me         CH2NHME         NO2         Me         CH2NHME         Me         H           CH2Ph         Et         CH2Ph         OH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         nPr         CH2Ph         H         H         H		Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et				
CH2NH2         H         Ph         CH2NH2         NHMS         Ph         CH2NH4         Ph         H           CH2NHMB         Me         CH2NHMB         NO2         Me         CH2NHMB         Me         H           CH2Ph         Et         CH2Ph         CH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         CH2Ph         CH         Et         H         H		H	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr				
CH <sub>2</sub> NHMe Me Me CH <sub>2</sub> NHMe NO <sub>2</sub> Me CH <sub>2</sub> NHMe Me H CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph H		Н	Ph			Ph				
CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph H H		Мe	Me		NO <sub>2</sub>		(			
CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph H H		Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH					
		n₽r	nPr		COMe	nPr				
		Ph	₽h		COOH	Ph	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

【0174】

HN-R			
HN	HN OH	ни	HN
HN		HN	
HN	HN F	~ ~ ~	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
HN	HN	HN	F HN N
	HN CI	HN F	HN
HN	····	.    -3	HN/\\S\
HN	HN	HN	HN~~O~
HN	HN	ни соон	HN
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		ни-ме	HN N CI
ши .	HN	HN	N.
ни	HN		HN
HN	HN	N OH	
0	1 7 5 <b>]</b>		

【表7】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>1 4</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	н	CHÔ	Н	н	Н	CHO
н	Н	nPr	н	SO₃H	Н	Н	н	so₃H
Н	н	nBu	н	ci	Н	Н	Н	CI
н	H	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Εt	Et	Eŧ	CONHMe
Et	Н	ìPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	Н	n₽r	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	H	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	₽h	Εŧ	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	Cĺ	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	Cl	CH₂OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	n₽r	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	C1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εŧ	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
			~ 1					

【0176】

			K					
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	Н	Н	NO <sub>2</sub>
H	н	iPr	Н	CHŌ	Н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	Н	SO₃H	Н	Н	Н	SO₃H
Н	н	nBu	н	CI	Н	н	Н	CI
H	Н	tBu	Н	Br	H	н	Н	Br
Me	н	₽h	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Мe	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	n₽r	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	H	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	H	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	ıPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	ıPr	NHMs	nPr	ıPr	n₽r	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	₽h	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	Cl	CH₂OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	₽h	CH2CH2P1	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н
		$\frac{1}{1}$ 7	7					
	Ι,	, 1 1	' 4					

出証特2005-3008820

【表 9 】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14				- 14	**	-14
		, ,	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R13	R14
Н	н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н	н	Н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	Н	so₃H	н	Н	Н	so₃H
Н	Н	nBu	Н	Cl	Н	Н	H	CI
н	Н	tBu	Н	Br	Н	Н	Н	Br
Мe	н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	n₽r	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	กBน	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	₽h	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO <sub>3</sub> H	Εt	Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH₂OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Εt	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH.	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

## 【0178】 【表10】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
H	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	н	н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	iPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
н	Н	nPr	Н	so₃H	Н	н	н	so₃H
Н	Н	nBu	н	ci	Н	н	Н	Cl
Н	Н	tBu	H	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	H	$CH_2NH_2$
Me	iPr	H	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	H	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	ιPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	n₿u	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	₽h	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	SO₃H	Εt	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH₂OMe	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH₂OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH2NH2	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH.	Et	CH₂Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H

[0179]

HN-R			
HN ~~	ни	HN	HN
HN	HN	HN	HN N
HN ~ ~ ~	HN	HN	E HN N
	HN	HN F	HN
HN	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	HN \	HN S
HN	HN F	ţ . (^)	HN O
ни	HN ~	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN	HN
ни	HN		HN~N
ни	1801	N OH	

【0180】 【表12】

HN-R		
HN	HN OH HN	) HN \
HN	HN HN	HN N N
HN	F HN	, °
HN	HN Cl	F HN N
	HN THIN TO	= HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN	HN HN	HN~S
HN	F	HN~°
HN	HN COOH	HN
HN	HN OH HN NH2	HN N
HN	HN HN HN, Me	HN
HN	HN S HN	HN N CI
HN OH	HN	HN
HN	HN N OH	
0	181]	

【表13】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN N
HN ~~		HN \	
HN	HN F	HN~~	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
HN	HN CI		F HN N
	HN	HN	HN N
HN	HN	HN T	HN S
HN	F		HN~~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	ни	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	LINI	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
	HN	HN	HN N
HN OH	HN		0
ни	HN	N OH	

【0182】

R <sup>13</sup>	X	R <sup>13</sup>	Х
NO <sub>2</sub>	0	Me	0
CHO	0	Εt	0
SO <sub>3</sub> H	0	ιPr	0
a	0	nPr	0
Br	0	nBu	0
CH <sub>2</sub> OH	Q.	tBu	0
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	0	Ph	0
CH₂NHMe	0	CH <sub>2</sub> Ph	0
CH <sub>2</sub> Ph	SO	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	0
COMe	so	Me	S
COOH	SO	Et	S
CONH <sub>2</sub>	so	iPr	S
CONHMe	SO	nPr	S
CONHMs	SO	nBu	S
NHMs	SO	tBu	S
NHCOMe	SO	₽h	S
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	CH₂Ph	S
CHO	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	S
SO₃H	S	Me	SO <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> NHMe	SO <sub>2</sub>	Et	SO <sub>2</sub>
ОН	SO	<b>i</b> Pr	SO <sub>2</sub>
COMe	0	nPr	SO <sub>2</sub>
COOH	0	nBu	SO <sub>2</sub>
CONH <sub>2</sub>	0	tBu	SO <sub>2</sub>
CONHMe	0	₽h	SO <sub>2</sub>
CONHMs	Ö	CH₂Ph	SO <sub>2</sub>
NHMs	SO <sub>2</sub>	CH2CH2Ph	SO <sub>2</sub>
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	Me	SO
он	SO <sub>2</sub>	Et	SO
COMe	SO <sub>2</sub>	iPr	SO
COOH	SO <sub>2</sub>	nPr	SO

[0183]

		Me	
R <sup>13</sup>	Х	R <sup>13</sup>	х
NO <sub>2</sub>	0	Me	0
CHO	0	Εt	0
SO₃H	0	ıPr	0
Cl	0	nPr	0
₿r	0	nBu	0
CH₂OH	0	tBu	0
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	0	Ph	0
CH₂NHMe	0	CH₂Ph	0
CH₂Ph	SO	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	0
COMe	SO	Me	S
COOH	SO	Et	S
CONH <sub>2</sub>	SO	iPr	S
CONHMe	SO	nPr	S
CONHMs	SO	nBu	S
NHMs	SO	tBu	S
NHCOMe	SO	Ph	S
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	CH₂Ph	S
CHO	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	S
so₃H	S	Me	SO <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> NHMe	SO <sub>2</sub>	Et	SO <sub>2</sub>
OH	so	íPr	SO <sub>2</sub>
COMe	0	nPr	SO <sub>2</sub>
COOH	0	nBu	SO <sub>2</sub>
CONH <sub>2</sub>	0	tBu	SO <sub>2</sub>
CONHMe	0	Ph	SO <sub>2</sub>
CONHMs	0	CH <sub>2</sub> Ph	SO <sub>2</sub>
NHMs	SO <sub>2</sub>	CH₂CH₂Ph	SO <sub>2</sub>
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	Me	so
он	SO <sub>2</sub>	Et	so
COMe	$SO_2$	i₽r	SO
COOH	SO <sub>2</sub>	nPr	SO

【0184】 【表16】

R <sup>13</sup>	Х	R <sup>13</sup>	X
NO <sub>2</sub>	0	Me	0
CHO	0	Et	0
SO₃H	0	iPr	0
a	0	nPr	0
Br	0	nBu	0
CH <sub>2</sub> OH	0	tBu	0
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	0	Ph	0
CH₂NHMe	0	CH <sub>2</sub> Ph	0
CH <sub>2</sub> Ph	\$O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	0
COMe	SO	Me	S
COOH	SO	Εt	S
CONH <sub>2</sub>	SO	iPr	S
CONHMe	SO	nPr	S
CONHMs	so	nBu	S
NHMs	SO	tBu	S
NHCOMe	SO	₽h	S
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	CH₂Ph	S
CHO	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	S
SO₃H	S	Me	$SO_2$
SO <sub>2</sub> NHMe	SO <sub>2</sub>	Et	SO <sub>2</sub>
он	SO	iPr	SO <sub>2</sub>
COMe	0	nPr	$SO_2$
COOH	0	nBu	SO <sub>2</sub>
CONH <sub>2</sub>	0	tBu	SO <sub>2</sub>
CONHMe	0	₽h	SO <sub>2</sub>
CONHMs	0	CH <sub>2</sub> Ph	SO <sub>2</sub>
NHMs	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SO <sub>2</sub>
$NO_2$	SO <sub>2</sub>	Me	SO
он	SO <sub>2</sub>	Et	SO
COMe	SO <sub>2</sub>	íPr	SO
COOH	SO <sub>2</sub>	nPr	SO

[0185]

R <sup>13</sup>	х	R <sup>13</sup>	Х
NO <sub>2</sub>	0	Me	0
CHO	0	Et	0
so₃H	0	iPr	0
CI	0	nPr	0
Br	0	nBu	0
CH <sub>2</sub> OH	0	tBu	0
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	0	₽h	0
CH₂NHMe	0	CH <sub>2</sub> Ph	0
CH <sub>2</sub> Ph	SO	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	0
COMe	SO	Me	S
COOH	SO	Εt	S
CONH <sub>2</sub>	SO	iPr	S
CONHMe	SO	nPr	S
CONHMs	SO	nBu	S
NHMs	SO	tBu	S
NHCOMe	SO	Ph	S
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	CH₂Ph	S
CHO	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	S
SO₃H	S	Me	SO <sub>2</sub>
SO <sub>2</sub> NHMe	SO <sub>2</sub>	Et	SO <sub>2</sub>
он	so	iPr	SO <sub>2</sub>
COMe	0	nPr	SO <sub>2</sub>
COOH	0	nBu	SO <sub>2</sub>
CONH <sub>2</sub>	0	tBu	SO <sub>2</sub>
CONHMe	0	₽h	SO <sub>2</sub>
CONHMs	0	CH₂Ph	SO <sub>2</sub>
NHMs	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SO <sub>2</sub>
NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	Me	SO
он	SO <sub>2</sub>	Et	so
COMe	SO <sub>2</sub>	iPr	SO
COOH	SO <sub>2</sub>	nPr	SO

【表19】

【0188】 【表20】

【表20】

[0189]

【表21】 -Me Мe R13 R<sup>13</sup> R<sup>11</sup> Н Εt H H H Me Me iPr nPr nBu tBu ₽h NO<sub>2</sub> Ме СНО Me Me SO<sub>3</sub>H ĊĬ Εt CH<sub>2</sub>OH Εt CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> CH₂ÑHMe Et iPr CH₂Ph nPr nBu COMe COOH CONH<sub>2</sub> tBu Ph CONHMe CH<sub>2</sub>OH CONHMs CH<sub>2</sub>OH NHMs CH<sub>2</sub>OMe NHCOMe CH<sub>2</sub>OMe  $NO_2$ CHÔ CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub>NHMe CH<sub>2</sub>Ph nPr Cl F

[0190] 【表22】

. CI Εt

HN

CH<sub>2</sub>Ph CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Ph

 $\mathbf{R}^{11}$ 

[0191]

Εt

nPr Ph

CH<sub>2</sub>Ph

CH<sub>2</sub>Ph

CH2CH2Ph

HN-R			
HN	ни ОН	HN \	ни
HN	HN	HN	HN
HN	F.	HN~~	
HN	HN CI		-F HN ~ N
$\cap$	HN	HN	HN~N
HN ~~~	NH NH	HN HN	HN S
HN~	HN	, in ,	HN~~O~
HN	ни	ни соон	HN
HN	HN	F HN NH <sub>2</sub>	HN Î
HN	HN (	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN		HN N
ни	HN \	N OH	

## 【0192】 【表24】

HN-R			
HN ~	1119	ни	ни
HN	[د اا	HN ()	
HN	HN F	HN	
HN	HN		F HN
	HN	HN	HN N J
HN	HN NH:	HN F	HN~~S~
HN	F		HN ~ O
HN	HN ~ ~ ~ F	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HNOH	HN	N	
HN	ни	OH	

【表25】

HN-R			
HN ~	HN \	HN \	HN N
HN	óн	HN^	
HN	HN F	HN~~	l
HN	HN CI	HN \	-F HN ✓ N ✓
HN	HN	√√ <sub>F</sub>	HN N
$\cap$	HN	HN F	HN ~~°
HN	HN F	HN	HN O
HN		cooн F	
HN (	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN ~	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
HN	HN S	HN	N N
óH HN∕√√	ни	NOH	Ö
<u> </u>			

【0194】 【表26】

HN-R			
HN	HN \	HN C	HN
HN	он	ни	HN N N
HN	HN	HN \\	
HN	HN	HN \	F HN O
HN \	HN	√√ <sub>F</sub>	HN N
HN	HN	HN F	HN O
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN O	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN	THIN J	HN N
ни	ни	N OH	

HN-R			
ни	HN OH	HN	HN
HN	ни	HN	HN N N
HN	F	ни	, (
HN	HN	HN	F HN
HN	HN	√_F	HN S
HN	HN -	HN	HN O
HN	HN	ни Соон	HN~O
HN	HN	F HN	HN
$\bigcap$	óн <sub>HN</sub>	HN NH2	HN
HN		HN Me	N=>−CI
HN	HN	HN	N
HNOH	HN	N	HN
HN	ни	он	

### 【0196】 【表28】

HN-R			
HN	HN OH	ни	ни
HN	ни	HN	HN N N
HN	HN	HN \	E HN N
		HN	HN NO
HN \	HN	2 HN	HN~~S~
HN	HN F	ţ Î	HN~~0~
HN	HN ~	HN COOH	HN O
HN \	ни	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN <sub>-Me</sub>	HN N CI
HN \	HN	HN	HN N
о́н Ни О	HN	N OH	Ü

HN-R			
HN ~	HN OH	ни	HN N
HN		HN	HN
HN	HN F	HN~~	
HN \	HN	HN \	F HN
HN \	HN	√ <sub>F</sub>	HN N
	HN C	'2 HN	HN O
HN ~	HN F	ни Соон	HN O
HN		F (	
HN ~ .	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN ~
HN	HN \	HN HN Me	HN
HN —	HN	HN	HN N CI
ни ~~~	HN		HN N
ни он	HN	N OH	ŭ

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN
HN		HN	
HN	HN	HN \	····
HN	HN CI		F HN NO
HN	HN	HN	HN~\n\_j
~ ·	HN	HN F	HN S
HN	F		HN O
HN	HN	HN COOH	HN N
HN	ни	HN NH <sub>2</sub>	HN
	HM C	HN	HN
HN		HN . <sub>Me</sub>	HN N CI
HN	HN	HN	N
HN OH	HN		HN~N
HN	ни	N OH	

		【表3	1 ]
		F	$\widehat{}$
	R <sup>11</sup> 1	m~~	<b>"</b>
	м́м́	√_он	
<b>⊃</b> =	くまま	_Me	
	R <sup>12</sup>	O \ Me	
	R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>	_
	н	Me	
	Н	Et	
	H	íPr	
	H	nPr	
	H Me	nBu tBu	
	Me	≀Bu Ph	
	Me	CH <sub>2</sub> OH	
	Me	CH <sub>2</sub> OMe	
	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
	Me	Me	
	Et	$CH_2NH_2$	
	Et	CH <sub>2</sub> NHMe	
	Et	CH <sub>2</sub> Ph	
	ιPr	CH <sub>2</sub> Ph	
	nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	
	nBu	H	
	tBu Ph	Me H	
	CH2OH	Me	
	CH <sub>2</sub> OH	Et	
	CH <sub>2</sub> OMe	nPr	
	CH <sub>2</sub> OMe	Ph	
	$CH_2NH_2$	Н	
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	
	CH <sub>2</sub> NHMe	Et	
	CH <sub>2</sub> Ph	nPr Ph	
	CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph		
			-

## 【0200】 【表32】

R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>		
Н	Me		
н	Et		
Н	<b>i</b> Pr		
Н	nPr		
Н	nBu		
Me	tBu		
Me	Ph		
Me	CH <sub>2</sub> OH		
Me	CH <sub>2</sub> OMe		
Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		
Me	Me		
Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		
Et	CH <sub>2</sub> NHMe		
Et	CH₂Ph		
ιPr	CH₂Ph		
nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph		
nBu	Н		
tBu	Me		
Ph	н		
CH <sub>2</sub> OH	Me		
CH <sub>2</sub> OH	Et		
CH <sub>2</sub> OMe	nPr		
CH₂OMe	Ph		
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr		
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph		
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me		
CH₂NHMe	Et		
CH₂Ph	nPr		
CH <sub>2</sub> Ph	Ph		
CH2CH2Ph	CH₂Ph		
_			

[0201]

		【表 3	3]
$\mathbf{R}^{\mathbf{H}}$		-iν̄	<u> </u>
Ņ.	~	√ он	
o≕	1 1	-Me	
N	-	O Me	
R12			_
	R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>	
	Н	Me	•
	Н	Εt	
	Н	iPr	
	Н	nPr	
	Н	nBu	
	Me	tBu	
	Me	₽h	
	Me	CH <sub>2</sub> OH	
	Me	CH <sub>2</sub> OMe	
	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
	Me	Me	
	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
	Εt	CH <sub>2</sub> NHMe	
	Et	CH <sub>2</sub> Ph	
	iPr	CH <sub>2</sub> Ph	
	nPr	CH2CH2Ph	
	nBu	н	
	tBu	Me	
	₽h	н	
(	CH <sub>2</sub> OH	Me	
(	CH <sub>2</sub> OH	Et	
C	H <sub>2</sub> OMe	nPr	
C	H <sub>2</sub> OMe	₽h	
	H <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	
(	H <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	
(	$2H_2NH_2$	Ph	
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	
C	H₂NHMe	Et	
	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	
	CH <sub>2</sub> Ph	₽ħ	
Cl	1 <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	ı CH₂Ph	_
	7	0 0 0	ິດ '

【0202】 【表34】

[0203]

【表35】

HN-R			
HN ^	THIS	HN~~	HN
HN	óн	HN \	
HN	HN		HN
HN	HN	HN	F HN
$\sim$	HN	HN C	HN
HN	NH;	HN \	HN~~S~
HN \	HN F.	, F	HN~~O~
HN \	HN	HN COOH	HN~O
HN-	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN TO	HN	HN
HN	HN	HN Me	HN N CI
HN	ни ф	HN	HN N
HN OH	HN \	N OH	
T 0	2041		

【0204】 【表36】

	R <sup>B</sup>	HN O	
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Me	Н .,	NO₂ CHO
Н	Et	Н	
Н	ıPr	н	SO₃H
	0		

н	Me	_	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Et		Н	CHO
Н	ıΡr		Н	SO₃H
Н	nPr		Н	CI
H	nBu		Н	Br
н	tBu		Me	CH <sub>2</sub> OH
н	Ph		Me	$CH_2NH_2$
Me	Me		Me	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	Εt		Me	CH <sub>2</sub> Ph
Et	iPr		Me	COMe
Et	nPr		Me	COOH
iPr	nBu		Et	CONH <sub>2</sub>
nPr	tBu		Εt	CONHMe
nBu	Ph		Et	CONHMs
tBu	iPr		í₽r	NHMs
₽ħ	nPr		nPr	NHCOMe
CH <sub>2</sub> OH	nBu		nBu	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> OH	tBu		tBu	CHO
CH <sub>2</sub> OMe	₽h		Ph	SO₃H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt		CH <sub>2</sub> OH	SO₂NHMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	n₽r		CH <sub>2</sub> OH	ОН
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	(	CH₂OMe	COMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	a	(	CH <sub>2</sub> OMe	COOH
$CH_2NH_2$	F	1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NHMe	Cl		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe
CH₂Ph	Εt		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs
CH <sub>2</sub> Ph	nPr		$CH_2NH_2$	NHMs
CH₂Ph	₽h	C	H <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Me		CH <sub>2</sub> Ph	OH
Н	CH <sub>2</sub> Ph		CH <sub>2</sub> Ph	COMe
Me	CH <sub>2</sub> Ph	_ 0	:H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH

[0205]

			Ivie	
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Me		Н	NO <sub>2</sub>
Н	Et		Н	CHO
Н	iPr		Н	SO₃H
н	nPr		н	a
н	nBu		Н	Br
Н	tBu		Me	CH <sub>2</sub> OH
н	₽h		Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	Me		Me	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	Εt		Мө	CH₂Ph
Et	i₽r		Me	COMe
Et	nPr		Me	COOH
iPr	nBu		Εt	CONH <sub>2</sub>
nPr	tBu		Εt	CONHMe
nBu	Ph		Et	CONHMs
tBu	iPr		ıPr	NHMs
₽h	n₽r		nPr	NHCOMe
CH <sub>2</sub> OH	nBu		nBu	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> OH	tBu		tBu	CHO
CH <sub>2</sub> OMe	Ph		Ph	SO₃H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt		CH <sub>2</sub> OH	SO₂NHMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr		CH <sub>2</sub> OH	OH
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h		CH <sub>2</sub> OMe	COMe
CH2NH2	CI	(	CH <sub>2</sub> OMe	COOH
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	F		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NHMe	CI	1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe
CH₂Pħ	€t		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs
CH <sub>2</sub> Ph	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs
CH₂Ph	₽h	C	:H <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>
CH₂CH₂Ph	Me		CH <sub>2</sub> Ph	он
н	CH <sub>2</sub> Ph		CH <sub>2</sub> Ph	COMe
Me	CH <sub>2</sub> Ph	_ 0	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH

## 【0206】 【表38】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
н	Me	_	Н	NO <sub>2</sub>
н	Εt		Н	CHO
н	iPr		Н	SO₃H
Н	nPr		H	a
н	nBu		Н	Br
Н	tBu		Me	CH₂OH
Н	₽h		Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	Me		Me	CH₂NHMe
Me	Εt		Me	CH₂Ph
Εt	i₽r		Me	COMe
Εt	nPr		Me	COOH
ίPr	nBu		Et	CONH <sub>2</sub>
nPr	tBu		Et	CONHMe
nBu	₽h		Et	CONHMs
tBu	íPr		iPr	NHMs
Ph	nPr		nPr	NHCOMe
CH <sub>2</sub> OH	nBu		nBu	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> OH	tBu		tBu	CHO
CH <sub>2</sub> OMe	₽h		Ph	SO₃H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt		CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr		CH <sub>2</sub> OH	он
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	(	CH <sub>2</sub> OMe	COMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	ŧ	CH₂OMe	COOH
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	F	1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NHMe	Cl	1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe
CH₂Ph	Εt	1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs
CH <sub>2</sub> Ph	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs
CH <sub>2</sub> Ph	Ph	C	H <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Me		CH <sub>2</sub> Ph	он
¯H "	CH <sub>2</sub> Ph		CH <sub>2</sub> Ph	COMe
Me	CH <sub>2</sub> Ph	_	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH

【表39】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Me	-	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Εt		Н	CHO
Н	ıPr		Н	SO₃H
н	nPr		Н	Cl
Н	nBu		Н	Br
Н	tBu		Me	CH <sub>2</sub> OH
Н	₽h		Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	Me		Me	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	Εt		Me	CH <sub>2</sub> Ph
Et	iPr		Me	COMe
Et	nPr		Me	COOH
iPr	nBu		Εt	CONH <sub>2</sub>
nPr	tBu		Εt	CONHMe
nBu	₽h		Et	CONHMs
tBu	iPr		iPr	NHMs
Ph	nPr		n₽r	NHCOMe
CH <sub>2</sub> OH	nBu		nBu	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> OH	tBu		tBu	CHÖ
CH <sub>2</sub> OMe	₽ħ		₽h	SO₃H
CH <sub>2</sub> OMe	Et		CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr		CH <sub>2</sub> OH	ОH
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	(	CH <sub>2</sub> OMe	COMe
CH2NH2	a	(	CH <sub>2</sub> OMe	COOH
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	F	ť	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> NHMe	Cl	(	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe
CH₂Ph	Εt	(	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs
CH <sub>2</sub> Ph	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs
CH₂Ph	₽h	С	H <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Me		CH <sub>2</sub> Ph	ОH
¯H ¯	CH <sub>2</sub> Ph		CH <sub>2</sub> Ph	COMe
Me	CH <sub>2</sub> Ph	С	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH
		_		

### 【0208】 【表40】

HN H	HN-R			
HN HN HN F HN N HN S HN O HN O HN N HN N HN N N O HN N N N		HN OH	HN~~	ни
HN HN F HN S  HN S	_		HN	HN
HN HN S  HN	$\bigcup$	1 1	HN \	F HN
HN HN HN COOH  HN OH  H			HN C	HN
HN HN COOH HN O HN O HN O HN O HN O HN O	HN		HN~~~	0
HN HN OH HN NH2 HN HN NH2 HN H	$\Box$	F	HN \	0 .
HN H			.F	
HN HN HN HN N	HN ~	óн	NH <sub>2</sub>	Z =
HN J HN N HN N N N N N N N N N N N N N N	1	HN \	HN HN Me	N=>-cı
OH HN TO HN N	i	s 🏠	HN	TW
1 ''' N 1	HN OH	HN	N OH	

HN-R			
HN~	HN \	ни	HN
HN ~~~	о́н О	HN \	HN N N
HN	HN F	HN~~	
HN	HN	HN~	F HN N
HN \	HN	F	HN N
$\cap$	HN	HN F	HN S
HN	F (	HN	HN O
HN ~	HN	.F	_N
HN \	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN —		HN Me	HN N CI
	HN	HN	N N
HN OH	HN	N	<i>B</i>
	LIN X	., он	

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN
HN	HN	HN O	HN ON ON
HN	F	HN	°
HN	HN	HN	F HN
HN	HN NH	_    _	HN S
HN N	HN F.	HN	ни~~_о~
HN	HN ~	HN COOH	HN O
HN	HN OH	HN	ни
HN		HN NH2	HN
ни	HN \	HN-Me	HN N CI
HN \	HN S	HN	LN NH
ни Он	HN	N OH	0
0	2 1 1 ]		

【表43】

HN-R			
HN ~	HN \	ни	HN
HN	óн 	HN	Ö
HN	HN	HN~~	HN T
HN	HN CI		F HN
	HN~	HN F	HN ~ \\
HN	1 1	H <sub>2</sub>	HN~~S~
HN	) HN F	f (^)	HN~~O~
HN \	. HN	HN COOH	HN~°C
HN	HN OH	.F HN NH <sub>2</sub>	HN
HN		HN	HN
HN	LIN C	HN-Me	HN N CI
l	HN \	HN	N N
HN OH	HN		ď
- B	2121	он	

【0212】 【表44】

H H Et H NO2 H H H H NO2 H H H H NO2 H H H H IPT H CHO H H H H CHO H H H H H CHO H H H H							R <sup>11</sup>	_13	R <sup>14</sup>
H H IP H CHO H H H H CHO H H H IP H SO5H H H H SO5H H H H NBU H C H H H H CO H H H H BB H CH2OH H ME H CH2OH ME EL Ph ME CH2OH H ME H CH2NH ME IP H ME CH2NH H ME H CH2NH ME IP H ME CH2NH H ME H CH2NH ME IP H ME CH2NH H ME H CH2NH ME NBU H ME COOH H ME H CH2NH ME NBU H ME COOH H ME H COOH EL Ph H EL CONH EL Ph H EL CONH EL H IP EL CONH EL H IP EL CONH EL H IP EL CONH IP H NP IP NHMS NP IP EL IP CONH IP H NBU NP NHCOM NBU H BU NBU NO2 HBU NBU NBU H BU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU NBU	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	₹14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R"	K.	R''
H H NPr H SO <sub>3</sub> H H H H H SO <sub>3</sub> H H H H H SO <sub>3</sub> H H H H NBU H CI H H H CI H H B CI H	Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н			
H H H nBu H Cl H H H Gl H H H NBu H Cl H H H H Gl H H H Me CH2OH H Me H CH2NH Me Et Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NH Me nPr H Me CH2NH H Me H CH2NH Me nPr H Me CH2Ph H Me H CH2NH Me nBu H Me CH2Ph H Me H CM2Ph Me nBu H Me COME H ME H CM2Ph Me nBu H Me COME H ME H CM2Ph Me tBu H Me COMH H ME H COMH Me tBu H Me COMH H ME H COMH Me tBu H ME COMH H ME H COMH Et Ph H Et CONHM Et Et ET CONHM Et H Ph H Et CONHM PR TET PR NPr H NPr 1Pr NHMS NPr NHCOM NBU NPR NHCOM NBU H ME NO2 TBU NPR NHCOM NBU NPR NHCOM NBU H BU NBU NO2 TBU NBU NPR NHCOM NBU H BU NBU NO2 TBU NBU NPR NHCOM NBU H Ph TBU CHO Ph TBU NPR NHCOM NBU H Ph TBU CHO Ph TBU NPR NHCOM NBU H Ph TBU CHO Ph TBU NPR NHCOM NBU H Ph TBU CHO Ph TBU NPR NHCOM NBU H Ph TBU CHO Ph TBU NPR NHCOM NACH CH2OH CI NPR CH2OH SO2NM NPR CH2OH NPR H H CH2OH CI NPR CH2OH COMH CI CI CH2OME CI CI CH2OME ET CI CH2OME COMH CI CH2OME CI CI CH2OME TP CI CH2NH2 CONHM2 ET CH2NH2 CI CI CH2NH2 Ph CI CH3NH2 CONHM2 ET CH2NH2 ET H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH2 ET H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH2 ET H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR CH2NH3 NPR H CH3NH3 H PP CH2NH3 NPR CH3NH3 NPR CH2NH3 NPR CH3NH3 NPR		H	iPr	Н	CHÖ	Н			
H H H 180 H CI H H H H CI H H H 180 H Br H H H H Br Me H H H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NH Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NH Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NH Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NH Me IPr H Me CH₂NHMe H Me H CH₂NH Me IBU H Me COM H Me H COOH Et Ph H Et CONH Et H Et Et CONH Et H IPr Et CONH Et H IPr Et CONH IPr IPr NHMS IPr IPr IPr ONH IPR INBU INBU IND INBU		Н	nPr	H	SO <sub>3</sub> H	н			
Me         H         H         Me         CH₂OH         H         Me         H         CH₂OH           Me         Et         Ph         Me         CH₂NHe         H         Me         H         CH₂NH           Me         IPr         H         Me         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe           Me         nBu         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COMH         H         Me         H         CONH         H         Et         L         CONH         H         Et         L         CONH         Me         H         CONH         H         CONH         H         CONH         H         Me	н	Н	nBu	H	CI	Н			
Me         Et         Ph         Me         CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H         Me         H         CH <sub>2</sub> NH           Me         iPr         H         Me         CH <sub>2</sub> NHMe         H         Me         H         CH <sub>2</sub> NHMe         H         Me         H         CH <sub>2</sub> NHMe         H         Me         H         CH <sub>2</sub> NHMe         H         COMB         H         Me         H         COMB         H         L         COMB         H         L         COMB         H         L         COMB         L         COMB         H         L         COMB         H         L         COMB         N         N         N         N         N         N         N         N         N         N         N         N         N <t< td=""><td>н</td><td>Н</td><td>tBu</td><td>Н</td><td>Br</td><td>н</td><td></td><td></td><td></td></t<>	н	Н	tBu	Н	Br	н			
Me         IPr         H         Me         CH2NIMME         H         Me         H         CH2NIMME           Me         nPr         H         Me         CH2NIMME         H         Me         H         CH2NIMME           Me         nBu         H         Me         COME         H         Me         H         COOH           Et         Ph         H         Et         CONHME         Et         Et         H         CONHME           Et         H         IE         Et         CONHME         Et         Et         Et         CONHME           Et         H         IP         ET         CONHME         Et         Et         ET         CONHME           Et         H         IP         ET         CONHME         ET         ET         CONHME           IP         H         nPr         IP         NHMS         nPr         IPr         NPMM         NHCON           IP         H         nBu         nPr         IP         NHMS         NPr         IPr         NHMS         NHCON         NHMS         NPr         IPr         nBu         NHCON         NHMS         NHCON         NHMS         NHCON <td>Мe</td> <td>H</td> <td>H</td> <td>Me</td> <td>CH<sub>2</sub>OH</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>	Мe	H	H	Me	CH <sub>2</sub> OH				
Me         nPr         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COMe           Me         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         Ph         H         Et         COOH         H         Bu         H         COOH           Et         Ph         H         Et         COOH         H         Bu         H         COOH           Et         H         Bt         COOH         H         Bt         Et         Et         COOH           Et         H         Bt         COOH         Bt         F         IPr         COOH           IPr         H         mPr         IPr         NHMS         nPr         IPr         OPr         NHMS           nBu         H         tBu         nPr         NHCOM         NBu         nPr         nPr         NHMS           nBu         H         tBu         nPr         NHCOM         NP         NHMS         NP         NP         NHMS         NP	Me	Et		Me					
Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COMe           Me         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COME           Et         tBu         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         tPh         H         Et         Et         CU         CONHMB         Et         Et         Et         CONHMB         Et         Et         Et         CONHMB         Et         CONHMB         Et         CONHMB         Et         CONHMB         Et         CONHMB         Et         Et         Et         CONHMB         Et         CONHMB         Et         Et         Et         CONHMB         Et         Et         Et         Et         CONHMB         Et         Et         H         NBU         NBU         NBU         NBU         NBU         NBU	Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe				
Me         IBU         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         Ph         H         Et         CONHA         Et         Et         H         CONHA           Et         H         Et         Et         CONHA         Et         Et         Et         CONHA           Et         H         IPr         Et         CONHA         IPr         Et         Et         CONHA           Et         H         IPr         Et         CONHA         IPr         Et         Et         CONHA           IPr         H         nPr         Et         CONHA         IPr         IPr         CONHA           IPr         H         nPr         IPr         NHCON         Ph         LBU         N	Me	nPr		Me	CH <sub>2</sub> Ph				
Et	Me	nBu		Me	COMe				
Et H Et Et CONHMe Et Et Et CONHMe Et H IPP Et CONHMe IPP Et IPP CONHME IPP H NPP IPP NHMS NPP IPP NHMS NHCOME NBU H 18U NBU NO2 18U NBU 18U NO3H 18U H Ph 18U CHO Ph 18U Ph H Ph CI Et Ph SO3H Et Ph Et H CH2OH CI NPP CH2OH OH Ph CH2OH NPP H CH3OME Et CI CH2OME COOH CI CH2OME CI CI CH3NH2 Ph CI CH3NH2 CONHME IPP CH3NH2 ET H CH3NH2 Ph CI CH3NH2 CONHME ET CH3NH2 ET H CH3NH2 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 IPP H CH3NH2 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH2 H Ph CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 H ET CH3NH2 NHMS Ph CH3NH2 NP H CH3NH4 NM ME ME CH3NH4 NO2 ME CH3NH4 ME H CH3PH ET ET CH3Ph COOH Ph CH2CH3Ph Ph H CH3CH3Ph NP CH3CH3Ph COOH Ph CH3CH3Ph Ph H	Me	tBu		Me					
Et H IPr Et CONHMS IPr Et IPr CONHMS IPR IPR IPR NIHMS IPR IPR IPR NIHMS IPR IPR IPR NIHMS IPR	Et	Ph		Et					
Pr	Et	н		Et					
	Et			Et	CONHMs				
NBu	ıPr								
tBu         H         Ph         tBu         CHO         Ph         tBu         Ph         H           Fh         CI         Et         Ph         SO <sub>2</sub> H         Et         Ph         Et         H           CH <sub>2</sub> OH         CI         nPr         CH <sub>2</sub> OH         SO <sub>2</sub> MMe         nPr         CH <sub>2</sub> OH         nPr         H	nPr								
Ph Ci Et Ph SO <sub>2</sub> H Et Ph Et H  CH <sub>2</sub> OH Cl nPr CH <sub>2</sub> OH SO <sub>2</sub> NMe nPr CH <sub>2</sub> OH nPr H  CH <sub>2</sub> OH Cl Ph CH <sub>2</sub> OH OH Ph CH <sub>2</sub> OH Ph H  CH <sub>2</sub> OMe nPr Cl CH <sub>2</sub> OMe COME Cl CH <sub>2</sub> OMe Cl Cl  CH <sub>2</sub> OMe nPr Cl CH <sub>2</sub> OMe COOH Cl CH <sub>2</sub> OMe Cl Cl  CH <sub>2</sub> OMe nPr Cl CH <sub>2</sub> OMe COOH Cl CH <sub>2</sub> OMe Cl Cl  CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph Cl CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub> Cl CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Et H  CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Et CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONHME Et CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Et H  CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONHMS nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> nPr H  CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H  CH <sub>2</sub> NHMB Me Me CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H  CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Me H  CH <sub>2</sub> Ph nPr CH <sub>2</sub> Ph COME nPr CH <sub>2</sub> Ph Ph H  CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph COOH Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph H	nBu	Н		nBu					
CH2OH									
CH2OH	Ph								
CH20Me         Et         CI         CH20Me         COMe         CI         CH20Me         CI         CI         CI         CI         CH20Me         COMe         CI         CH20Me         CI         CI         CH20Me         CI         CI         CH20Me         CI         CH20Me         CI         CI         CI         CH20Me         CI         CI         CI         CH20Me         CI         CI         CI         CH20Me         CI	CH <sub>2</sub> OH								
CH30Me nPr CI CH20Me COOH CI CH20Me CI CI CH20Me nPr CI CH20Me COOH CI CH20Me CI CI CH20Me Pr CH20Me Pr CI CH20Me CI CI CH20Me Pr CH20Me Pr CI CH20Me Pr CH20Me P CH20Me Pr CH20Me Pr CH20Me Pr CH20Me Pr CH20Me P CH20Me P CH20Me	CH <sub>2</sub> OH								
CH2NH2         Ph         CI         CH2NH2         CONH2         CI         CH2NH2         CI         CI         CI         CI         CH2NH2         CONHMB         Et         CH2NH2         Et         H         CH2NH2         CONHMB         nPr         CH2NH2         Pr         H         Pr         CH2NH2         Pr         H         Pr         CH2NH2         Pr         H         H         Pr         H         Pr         CH2NH2         Pr         H         H         Pr         CH2NH2         Pr         H         H         Pr         CH2NH2         Pr         H         H           CH2NHM6         Me         CH2NHM6         NCO2         Me         CH2NHM6         Me         H           CH2Ph         Bt         Et         CH2Ph         OH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         nPr         CH2Ph         CM         nPr         CH2Ph         Ph         H           CH2CH2Ph         Ph         Ph         CH2CH2Ph         Ph         CH2CH2Ph         Ph         H									
CH3NH2         H         Et         CH3NH2         CONHME         Et         CH2NH2         Et         H           CH3NH2         H         nPr         CH3NH2         CONHMS         nPr         CH2NH2         nPr         H           CH3NH2         H         Ph         CH3NH2         NHMS         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NHM6         Me         Me         CH2NHM6         NO2         Me         CH2NHM6         Me         H           CH3Ph         nPr         CH2Ph         OH         Et         CH3Ph         Et         H           CH3Ph         nPr         nPr         CM2Ph         COMe         nPr         CH2Ph         nPr         H           CH3CH3Ph         Ph         Ph         CH3CH3Ph         COOH         Ph         CH3CH3Ph         Ph         H									
CH3/NH2 H									
CH3/NH2         H         Ph         CH3/NH2         NHMS         Ph         CH3/NH2         Ph         H           CH3/NH3         H         Ph         CH3/NH4         NHMS         Ph         CH3/NH4         Ph         H           CH3/NHM6         Me         CH3/NHM6         NO2         Me         CH3/NHM6         Me         H           CH3/Ph         Et         Et         CH3/Ph         OH         Et         CH3/Ph         Et         H           CH3/Ph         nPr         nPr         CH3/Ph         CH         CH3/Ph         Ph         CH3/Ph         Ph         CH3/Ph         Ph         H           CH3/CH3/Ph         Ph         Ph         CH2/CH3/Ph         Ph         CH3/CH3/Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>								
CH2NHMe         Me         CH2NHMe         Me         CH2NHMe         Me         H           CH2Ph         Et         CH2Ph         CH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         Ft         Ft         CH2Ph									
CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph COOH Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph H	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>								
CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph COOH Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph H									
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph COOH Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph H									
Chachart III III Chachart III C									
	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph Ph	Ph		n COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph_	Н

 $[0\ 2\ 1\ 3]$ 

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>1 4</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R11	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	н	NO <sub>2</sub>	Н	н	Н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	Ĥ	СНО	н	н	H	CHO
Ĥ	Н	nPr	Н	so₃H	н	н	Н	SO₃H
H	н	nBu	Н	αĭ	Н	н	Н	Cl
H	н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Εt	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Εt	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHME
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ıPr	Et	íPr	CONHMS
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOM
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub> H
tBu	н	Ph	tBu	сно	₽h	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	₽h	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NMe	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	n₽r	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	ÕН	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	лPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHM e	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHME	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Εt	CH₂Ph	OH	Et	CH₂Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	ı Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

#### 【0214】 【表46】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н	н	Н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	Н	CHÔ	Н	Н	н	CHO
н	Н	n₽r	Н	SO₃H	Н	Н	н	so₃H
H	Н	nBu	н	ď	Н	н	н	CI
H	Н	tBu	Н	Br	Н	Н	н	Br
Me	н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	н	$CH_2NH_2$
Me	íPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	H	Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Ме	COMe	Н	Me	H	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н	Me	н	COOH
Et	₽h	н	Εt	CONH <sub>2</sub>	н	Et	н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Εt	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	íPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	₽h	Н
Ph	Cl	Et	Ph	\$O₃H	Εt	Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	₽h	Н
CH₂OMe	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Pn	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH₂Ph	n₽r	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	h Ph	Н

[0215]

【表47】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	Н	NO <sub>2</sub>
H	н	iPr	Н	CHO	н	Н	Н	CHO
H	Н	nPr	Н	SO <sub>3</sub> H	н	н	н	SO₃H
H	Н	nBu	Н	ď	н	н	Н	Cl
н	Н	tBu	н	8r	н	Н	Н	Br
Me	н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	н	CH₂NH₂
Me	ıPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	cH₂Ph	Н	Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	н	COMe
Ме	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	€t	н	CONH <sub>2</sub>
Εt	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Εt	н	1Pr	Et	CONHMs	í₽r	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	íPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	₽h	tBu	₽h	Н
Ph	CI	Et	Ph	s೦₃H	Œt	Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH₂OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH2NH2	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	2 MHN	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH₂NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH₂Ph	Et	Н
CH₂Ph	n₽r	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph T	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	H
	/	1 0 1	1					

【0216】 【表48】

HN-R			
HN	HN \	HN	HN N
HN	óн	HN	HN N N
HN	HN F	HN	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
HN	HN CI		F HN N
	HN	HN	HN
HN~~	HN NI	HN F	HN S
HN	F		HN O
HN	HN ~	HN COOH	HN
HN	ни	HN	HN
		NH <sub>2</sub>	HN
HN		HN. <sub>Me</sub>	HN N CI
HN	HN	HN	N
HN OH	HN		HN N
ни	HN \	N OH	

[0217]

【表49】

R <sup>13</sup> R <sup>14</sup> R <sup>15</sup> R <sup>13</sup> R <sup>14</sup> R <sup>15</sup> R <sup>13</sup> R <sup>14</sup> R <sup>15</sup> H H H Et NO <sub>2</sub> H Et H NO <sub>2</sub> Et H H H Pr CHO Pr CHO H Pr H CHO Pr H H CONHO Pr H H H CONHO Pr H Pr H CONHO Pr H Pr H CONHO Pr H Pr H CONHO Pr H CONH				K					
H H IPT CHO H IPT H CHO IPT H H H H NPT SO <sub>3</sub> H NPT H SO <sub>3</sub> H NPT H H NPD H H SO <sub>3</sub> H NPT H NPD H H CH₂NHM H H H CONH H H H NPT H H NPT H NPT	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
H H nPr SO3H H nPr H SO3H nPr H H H H nBu CI nBu CI nBu H CI nBu H H CI nBu H H Br tisu H Br tisu H H CH2NH2 H H CH2NH2 H H CH2NH3 H H COMM H H H Pr H COMM N Pr H nPr NHMS H H NPr H NHMS NPr H nPr NHMS H H NP NHMS NPr H NP NHMS H H NP NHMS NP H NP NHMS H H NP NHM H NO2 H H NP NHM H NO2 H H NP NHM H NO2 H H NP NHM H NO3 H NO2 H H NP NHM H NO3 H NO3 H NO3 H NO4 H NP NHM NO4 H NO5 NHM	Н	н –	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н		
H H H BU CI H BU H CI BBU H BI H BU H BI BI BI BI H BI	Н	Н	iPr	CHO	Н	iPr	Н		ıPr
H H tBu Br H tBu H Br tBu H H Ph CH <sub>2</sub> OH H Ph Et H H CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H H H CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H H H CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H H H CH <sub>2</sub> NH <sub>3</sub> H IPr H H CH <sub>2</sub> NHMe H H H CH <sub>2</sub> NHMe H IPr H H COME H H H COME H IBu H H COOH H H H COOH H IBu H H COOH H H H COOH H IBu H H COOH H H H COOH H IBu H H COOH H H H COOH H IBU H H COOH H H H COOH H IBU H H COOH H H H COOH H IBU H H COOH B B H H BU NOOH H IBU H NOOH B B H BU NOO H IBU H H COOH B B H H BU NOO H IBU H NHMS IPr H IPR COOHMS H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NHOOM IBU H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H NOO B B H IBU NOO H IBU H OOH B B H IBU NOO H IBU H OOH B H IBU NOO H IBU H IBU H OOH B H IBU NOO H IBU H IBU H OOH B H IBU NOO H IBU H IBU H OOH B H IBU NOO H IBU H IBU H OOH B H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H IBU H IBU H IBU NOO H IBU H	Н	Н	n₽r	SO₃H	н				
H H Ph CH2OH H Ph H CH2OH Ph Ett H H CH2NH2 H H H CH2NH2 H IPT H H CH2NHM6 H H H CH2NHM6 H nPr H H COM H H H H COM H nBu H H COOH H H H COOH H Ph H COOH H H H COOH H Ph H COOH H H H COOH H Ph H H COOH H H H COOH H Ph H H COOH B H H H COOH H Ph H H COOH B H H H COOH B Ph H H COOH B H H H COOH B Ph H H COOH B H H H COOH B Ph H H COOH B H H H COOH B H Pr H COOH B B H B B WOO B H Pr H COOH B B B B WOO B H NHOO B B B B WOO B H BU NO B B B B WOO B H BU NO B B B B B B B B B B B B B B B B H SO B B B B B B B B B B B B B B B B B B	Н	Н	nBu	a	н	nBu			
Et H H CH_NH_2 H H H CH_NH_2 H  IPT H H CH_NHMe H H H CH_NHMe H  IPT H H COMP H H H COMP H  IBU H H COOH H H H COMP H  IPT H CONHME Et H ET CONHME H  H IPT H CONHMS IPT H IPT CONHMS H  H IPT H CONHMS IPT H IPT CONHMS H  H IPT H CONHMS IPT H IPT CONHMS H  H IPT H NHMS INT H IPT CONHMS H  H IBU H NHCOME IBU H IBU NHCOME H  H IBU H NO2 IBU H IBU NO2 H  H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H  CI ET H SO3H ET H ET COOH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H COOME IBU H IBU NO2 H  H OH Ph H CHO Ph H Ph H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H SO3NHME IPT H IPT H OH  CI IPT H COOME II H III INTINITY INTINIT	н	н	tBu	Br	Н	tBu			
IPT	Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	н				
nPr         H         H         CH2Ph         H         H         H         CH2Ph         H           nBu         H         H         COMP         H         H         H         COMPh         H           Ph         H         H         H         COMPh         H         H         H         COMPh         H           Ph         H         H         COMPh         H         H         H         COMPh         H           Ph         H         H         COMPh         H         H         H         COMPh         H           H         H         H         COMPh         H         H         H         COMPh         H         H         H         COMPh         H         H         COMPh         H         H         NPCONHMS         H         H         NPCONHMS	Et *	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н				
nBu         H         H         COMe         H         H         H         COMe         H           tBu         H         H         H         COOH         H         H         H         COOH         H           Ph         H         H         COOH         H         H         H         COOH         H           H         H         H         COOH         H         H         H         COOH         H         H         L         COOH         H         H         L         COOH         H         H         IPr         COOH         COOH         H         NH         NH         H         NH         H         NH         NH         H         NH         NH         H         NH         NH         H         NH         NH <t< td=""><td>iPr</td><td>н</td><td>Н</td><td>CH<sub>2</sub>NHMe</td><td>Н</td><td>Н</td><td>Н</td><td></td><td></td></t<>	iPr	н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н		
TEBU	nPr	H	Н	CH₂Ph	Н				
Ph H H CONH <sub>2</sub> H H H CONH <sub>2</sub> H H Et H CONHMe Et H Et CONHMe H H IPr H CONHMS IPr H IPr CONHMS H H nPr H NIMS nPr H nPr NIMS H H nBu H NHCOME nBu H nBu NHCOME H H tBu H NO <sub>2</sub> tBu H tBu NO <sub>2</sub> H H Ph H CHO Ph H Ph H SO <sub>3</sub> NIM CI Et H SO <sub>3</sub> H Et H Et H SO <sub>2</sub> NIM CI nPr H SO <sub>2</sub> NIME nPr H nPr H OH CI nPr H OH Ph H Ph H COME Et CI H CONH CI H CI CI CONHME H CONH CI H CI CI CONHME H CONHME ET CI ET H CONHME H ET CI CONHME ET CI ET H CONHME H Ph CI NIMMS Ph CI PP H NP <sub>2</sub> H NO <sub>2</sub> MME ME H NO <sub>2</sub> ME H ME H OH DH H OH ET H CONHME	nBu	Н	Н	COMe	н	Н			
H Et H CONHMe Et H Et CONHMe H H IPT H CONHMS IPT H IPT CONHMS H H nPT H NHMS nPT H nPT NHMS H H nBU H NHCOME nBU H nBU NHCOME H H tBU H NO2 tBU H tBU NO2 H H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H SO3H CI nPT H SO3NHME nPT H nPT H COME Et CI H COME CI H CI CI CONHM Et CI H CONH2 CI H CI CI CONHM ET CI CI CONHME T CI CI CONHME H CONH2 CI H CI CI CONHME H CONH2 CI H CI CI CONHME H CONH2 CI H CI CI CONHME H NPT CI CONHME ET CI ET H CONHME H nPT CI CONHMS nPT CI nPT H NIMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 ME ME H NO2 ME H ME H COME ET ET H COME  NPT NPT H COME NPT H NPT H OH  ET ET CI CONHMS NPT CI NPT H NIMS  ME ME H NO2 ME H ME H COME  T NPT NPT H COME NPT H NPT H COME  T NPT NPT H COME NPT H NPT H COME	tBu	н	Н	COOH	H	Н			
H   Pr	Ph	Н	H	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н		
H	Н	Εt	Н	CONHMe					
H nBu H NHCOMe nBu H nBu NHCOMe H H tBu H NO₂ tBu H tBu NO₂ H H Ph H CHO Ph H Ph H SO₃H CI Et H SO₃H Et H Et H SO₂NHM CI nPr H SO₃NHMe nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COMe Et CI H COME CI H CI CI COOH nPr CI H CONH₂ CI H CI CI CONHM H Et CI CONHMe Et CI Et H CONHMH H nPr CI CONHMB ET CI ET H CONHMM H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO₂ Me Me H NO₂ Me H Me H OOME Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME	Н	iPr	Н	CONHMs	ĭ₽r				
H tBu H NO2 tBu H tBu NO2 H H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H S2,NHM CI nPr H SO2,NHM nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COMB Et CI H COMB CI H CI CI COH NPr CI H CONH2 CI H CI CI CONH2 Ph CI H CONH2 CI H CI CI CONH4 H Et CI CONHMB Et CI Et H CONHMB H nPr CI CONHMB nPr CI nPr H NIMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 MB MB H NO2 MB H MB H OH ET ET H COMB	Н	nPr		NHMs					
H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHM CI nPr H SO3NHME nPr H nPr H COME Et CI H COME CI H CI CI COOH NPT CI H COOH CI H CI CI COOH NPT CI H COOH CI H CI CI CONHM H CI CI CONHME ET CI ET H CONHM H nPr CI CONHMS NPT CI NPT H NPMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH ET ET H COME NPT NPT H COME NPT H NPT H COOH	Н	nBu	Н		nBu				
CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHM CI nPr H SO2NHM CI ph H OH Ph H nPr H OH CI ph H OH CI H CI CI COMB Et CI H COMB CI H CI CI CONHM NPr CI H CONH2 CI H CI CI CONHM H Et CI CONHMB Et CI Et H CONHM H nPr CI CONHMB ET CI ET H CONHMB H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 MB MB H NO2 MB H MB H OH ET ET H OH ET H COMB	Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>					
CI	Н	Ph	Н	CHO					
CI Ph H OH Ph H Ph H COME  Et CI H COME CI H CI CI COOH  nPr CI H CONH2 CI H CI CI CONH2  Ph CI H CONH2 CI H CI CI CONH4  H Et CI CONHM8 Et CI Et H CONHM8  H nPr CI CONHM8 nPr CI nPr H NHMS  H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2  Me Me H NO2 Me H Me H OH  Et Et H OH Et H Et H COME  nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	Cl	Et	н	SO₃H	Et	Н			
Et CI H COMe CI H CI CI COOH  nPr CI H COOH CI H CI CI CONH2  Ph CI H CONH2 CI H CI CI CONH4  H Et CI CONHM8 RP CI Et H CONHM  H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2  Me Me H NO2 Me H Me H OH  Et Et H OH Et H Et H COME  nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	Cl	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe					
nPr         Cl         H         COOH         Cl         H         Cl         CONH <sub>2</sub> CONH <sub>3</sub> Cl         CONHM         Cl         CONHM         Cl         CONHM         Cl         Cl         CONHM         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl         Cl         NPr         H         NPr	CI	Ph	Н						
Ph         Cl         H         CONHI         Cl         Cl         CONHM           H         Et         Cl         CONHM         Et         Cl         Et         H         CONHMS           H         nPr         Cl         CONHMS         nPr         Cl         nPr         H         NHMS           H         Ph         Cl         NHMS         Ph         Cl         Ph         H         NO2           Me         H         NO2         Me         H         Me         H         OH           Et         Et         H         OH         Et         H         Et         H         COME           nPr         nPr         H         COME         nPr         H         nPr         H         COOH	Εt	Cl	Н						
H Et CI CONHMe Et CI Et H CONHME H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	nPr	CI	Н	COOH					
H	Ph	CI	Н	CONH <sub>2</sub>					
H	Н	Εt	CI						
Me         Me         H         NO2         Me         H         Me         H         OH           Et         Et         H         OH         Et         H         Et         H         COMe           nPr         nPr         H         COMe         nPr         H         nPr         H         COOH	Н	nPr	CI	CONHMs					
Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Н	Ph							
nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Me	Me	Н	$NO_2$					
mi mi mi mi	Εt	Et	Н						
Ph Ph H COOH Ph H Ph H NO <sub>2</sub>	nPr	n₽r	Н						
	Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

# 【0218】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	_ 15	40					
	K	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	Н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ιPr
H	Н	nPr	SO₃H	Н	n₽r	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	CI	Н	nBu	Н	CI	nBu
Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
Н	Н	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH	
iPr	Н	н	CH₂NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHN	
nPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Н	н	CH₂P'n	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	н
tBu	Н	Н	COOH	н	Н	Н	COOH	
Ph	H	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
н	iPr	н	CONHMs	í₽r	Н	iPr	CONHM	
Н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	n₽r	NHMs	H
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	Н	$NO_2$	tBu	н	tBu	$NO_2$	Н
Н	Ph	Н	CHO	₽h	Н	₽ħ	Н	SO₃H
CI	Et	Н	so₃H	Εt	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	Н	SO₂NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	н	Ph	Н	COMe
Εt	CI	Н	COMe	CI	Н	CI	CI	COOH
nPr	a	Н	COOH	CI	Н	CI	CI	CONH <sub>2</sub>
Ρħ	CI	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	CI	CI	CONHMe
H	Et	CI	CONHMe	Ęŧ	Cl	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	Н	$NO_2$
Me	Me	н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	н	ОН	Εt	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	H	COOH	Ph	Н	Ph	н	NO <sub>2</sub>

[0219]

【表 5 1】

R<sup>13</sup> HN OH OH OH Me

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	н	iPr	CHŌ	Н	iPr	Н	CHO	iPr
Н	н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	SO₃H	nPr
н	Н	nBu	a	Н	nBu	H	Cl	nBu
н	Н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	н	Ph	Н	CH <sub>2</sub> OH	₽h
Et	Н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	Н	н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	Н	Н	COOH	н	Н	Н	COOH	н
Ph	н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	н	i₽r	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	н	nPr	NHMs	Н
н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	NO₂H	Н
Н	₽h	Н	CHO	Ph	Н	₽h	н	SO₃H
CI	Εt	Н	SO₃H	Εt	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	н	он
CI	Ph	Н	OH	Ρ'n	Н	Ph	Н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	н	CI	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	Cl	Н	CI	a	CONH <sub>2</sub>
Ph	Cl	Н	CONH <sub>2</sub>	Cl	H	CI	CI	CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Εt	Cl	Et	Н	CONHMs
н	nPr	Cl	CONHMs	nPr	Cl	nPr	Н	NHMs
Н	Ph	CI	NHMs	₽ħ	CI	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	н	он
Et	Et	н	ОН	Εt	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	n₽r	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н_	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

【0220】 【表52】

R13         R14         R15           H         H         H         R1         R14         R15         R13         R14         R15           H         H         H         R1         R1         R1         R14         R15           H         H         H         P1         H         CHO         PP         H         CHO         PP           H         H         N         P1         H         CHO         PP         H         CHO         PP           H         H         N         P1         P1         H         CHO         PP         H         CHO         PP         H         BBU         H         CHO         PP         H         H         H         CHO         PP         H <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>									
H H IPT CHO H IPT H CHO IPT H H P CHO IPT H H P CHO IPT H NPT CHO IPT H NPT H SO <sub>2</sub> H NPT H NPT H SO <sub>2</sub> H NPT NPT H NPT H SO <sub>2</sub> H NPT	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
H H IPT CHO H IPT H CHO IPT H H N CHO IPT H N CONHO IPT H N CHO IPT H N COME IPT H N CHO IPT H N CHO IPT H N CHO IPT H N CHO IPT H N CO IPT H N CHO IPT H N CO IPT H N	Н	н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H H nBu Cl H nBu H Cl nBu H H H H H H H H H CH₂NH₂ H H H CH₂NHMe H H H COMH H H H Pr H COMHMS iPr H iPr CONHMS H H iPr H COMHMS iPr H iPr CONHMS H H iPr H COMHMS iPr H iPr CONHMS H H iPr H COMHMS iPr H iPr CONHMS H H iBu NHCOME H IBu NO₂H H IBU			ıPr	CHÔ	н	iPr	Н		íPr
H H H 18u Br H 18u H Cl nBu H H 18r 18u H Br 18u B	н	Н	nPr	SO₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
H H Ph CH <sub>2</sub> OH H Ph H CH <sub>2</sub> OH Ph Et H CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H H H COM <sub>2</sub> H H H Pr H COM <sub>2</sub> H H H Pr COM <sub>2</sub> H H Pr NHMS NPr H NPr NHMS H NPr NHMS NPr H NPr NHMS H NPr NHMS NPr H NPr NHMS H NPCOMe NBU H NBU NO <sub>2</sub> H H NBU NO <sub>2</sub> H H NBU NO <sub>2</sub> H H NPh H COM Ph H Ph H SO <sub>3</sub> NHMe NPr H NPh H SO <sub>3</sub> NHMe NPr H NPr H OH COM <sub>2</sub> Et H Et H SO <sub>3</sub> NHMe NPr H NPr H COM <sub>2</sub> Et C NPr H SO <sub>3</sub> NHMe NPr H NPr H COM <sub>2</sub> Et C NPr C NHMS NPr C NHMS NPr C NPr C NHMS NPr C NPr C NHMS NPR C	Н	Н	nBu		Н	nBu	Н		
Et H H CH2NH2 H H H CH2NH2 H IPT H H CH2NHM6 H H H CH2NHM6 H IPT H H CH2NHM6 H H H H CH2NHM6 H IPT H H CH2NHM6 H H H H CH2NHM6 H IBU H H COM6 H H H H COM6 H IBU H H CONH2 H H H COM6 H IBU H H CONHM6 Et H ET CONHM6 H IPT H CONHM6 IPT H IPT CONHM6 H IPT H CONHM6 IPT H IPT CONHM6 H IPT H NHM5 IPT H IPT CONHM6 H IPT H NHM6 IPT H IPT CONHM6 H IPT H NO2 IBU H IBU NO2H H IPT H SO3H ET H ET H SO3NHM6 IPT H IPT H OH IPT IPT H COM6 IPT H IPT H OH IPT	Н	н	tBu	Br	Н	tBu			
	Н	Н	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	Н		
nPr         H         H         CH₂Ph         H         H         H         CH₂Ph         H           nBu         H         H         H         COMe         H         H         H         COMe         H           tBu         H         H         COMe         H         H         H         COMe         H           Ph         H         H         CONHMe         Et         H         H         CONHMe         H           H         Et         H         CONHMe         H         H         H         CONHMe         H           H         IPr         H         CONHME         IPr         H         IPr         CONHME         H           H         IPr         H         NHCOME         IBu         H         NPr         ONHMS         H           H         IPr         H         NHCOME         H         IPr         NHCOME         H         <	Et	Н	Н		Н	н			
nPr         H         H         CH₂Ph         H         H         H         CH₂Ph         H           nBu         H         H         H         COMe         H         H         H         COMe         H           tBu         H         H         COOH         H         H         H         COOH         H           Ph         H         H         COOH         H         H         H         COOH         H           H         Et         H         CONHMe         Et         H         Et         CONHMe         H           H         nPr         H         NHCOME         BBU         H         nBU         NHCOME         H           H         nBu         H         NHCOME         H         NHCOME         H         H         NHCOME	iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	н		
H	nPr	Н	Н	CH₂Ph	Н				
Ph H H CONH2 H H H CONH2 H H Et H CONHM6 Et H Et CONHM6 H H IPr H CONHM8 IPr H IIPr CONHM8 H H NPr H NHM8 NPr H NPr NHM8 H H NBU H NHCOM6 NBU H NBU NHCOM6 H H BU H NO2 IBU H IBU NO2H H H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHM6 CI NPr H SO3HM6 NPr H NPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COM6 Et CI H COM6 CI H CI CI CONHM8 H CONH2 CI H CI CI CONHM6 H Et CI CONHM6 ET CI ET H CONHM8 H NPr CI CONHM8 NPr CI PP H NHM8 H NPr CI CONHM8 NPR CI PP H NHM8 M6 M6 H NO2 M6 H M6 H OH NPR NPR H COM6 ET ET H COM6 NPR H NPR H NO2 M6 M6 H NO2 M6 H M6 H OH NPR NPR H COM6 ET ET H COM6 NPR H M6 H OH NPR NPR H NO2 M6 H M6 H OH NPR NPR H COM6	nBu	Н	Н	COMe	Н	H			
H	tBu	н	Н	COOH	Н				
H   IPr   H   CONHMS   IPr   H   IPr   CONHMS   H     H   nPr   H   NHMS   nPr   H   nPr   NHMS   H     H   nBu   H   NHCOMe   nBu   H   nBu   NHCOMe   H     H   tBu   H   NO2   tBu   H   tBu   NO2H   H     H   Ph   H   CHO   Ph   H   Ph   H   SO3H     CI   Et   H   SO3H   Et   H   Et   H   SO4NHME     CI   nPr   H   SO4NHME   nPr   H   nPr   H   OH     CI   Ph   H   OH   Ph   H   Ph   H   COME     Et   CI   H   COME   CI   H   CI   CI   CONHME     Et   CI   H   CONH2   CI   H   CI   CI   CONHME     H   Et   CI   CONHME   Et   CI   Et   H   CONHMS     H   nPr   CI   CONHMS   nPr   CI   nPr   H   NHMS     H   Ph   CI   NHMS   Ph   CI   Ph   H   NO2     ME   ME   H   NO2   ME   H   ME   H   OH     Et   Et   H   OH   Et   H   Et   H   COME     nPr   nPr   H   COME   nPr   H   nPr   H   COOH     NPR   NPR   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONPT   NPR   H   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONPT   NPR   H   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONPT   NPR   H   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   Ph   H   COOH     CONPT   NPR   H   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONPT   NPR   H   COME   NPR   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   COOH     CONPT   NPR   H   COOH   NPR   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   COOH     CONPT   NPR   H   COOH   NPR   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   COOH     CONPT   NPR   H   COOH   NPR   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   H   NPR   H   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   COOH     CONHMS   NPR   CI   PH   COOH     CONHMS   CONH   COOH   CONH   COOH     CONH   CONH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH     CONH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH     CONH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH   COOH     COOH   CO	₽h	Н	н	CONH <sub>2</sub>					
H	н	Εt	Н	CONHMe	Εt				
H nBu H NHCOMe nBu H nBu NHCOMe H H tBu H NO₂ tBu H tBu NO₂H H H Ph H CHO Ph H Ph H SO₃H CI Et H SO₃H Et H Et H SO₂NHMe CI nPr H SO₂NHMe nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COMe Et CI H COMe CI H CI CI COOH nPr CI H CONH₂ CI H CI CI CONH₂ Ph CI H CONH₂ CI H CI CI CONHME H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H nPr CI NHMS Ph CI Ph H NO₂ Me Me H NO₂ Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME	н	iPr	H	CONHMs	íPr				
H 185U H NO2 185U H 185U NO2H H H Ph H CHO Ph H Ph H SO3H CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHME CI nPr H SO2NHME nPr H nPr H COME Et CI H COME CI H CI CI COOH  Ph H OH Ph H CH CI CI COOH  PF CI H CONH2 CI H CI CI CONHME  H Et CI CONHME ET CI ET H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2  Me Me H NO2 Me H Me H OH  ET ET H COME  NPr NPr H COME	Н	nPr	Н	NHMs					
H Ph H CHO Ph H Ph H SO <sub>3</sub> H CI Et H SO <sub>2</sub> Ni-Me CI Et H SO <sub>2</sub> Ni-Me NPr H NPr H OH CI Ph H OH CI Ph H COMe CI H CI CI CONH <sub>2</sub> CI H CI CI CONH <sub>2</sub> CI H CI CI CONH <sub>2</sub> CI H CI CI CONH <sub>3</sub> CI H CI CI CONH <sub>4</sub> CI H CI CI CONH <sub>4</sub> CI CI CONH <sub>4</sub> CI CI CI CONH <sub>4</sub> CI CI CI CONH <sub>4</sub> CI CI CI CI CONH <sub>4</sub> CI CI CI CI CONH <sub>4</sub> CI	Н	nBu	Н	NHCOMe					
CI Et H SO3H Et H Et H SO2NHME CI nPr H SO2NHME nPr H nPr H OH CI Ph H OH Ph H Ph H COME Et CI H COME CI H CI CI COOH nPr CI H CONH2 CI H CI CI CONHME H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH Et Et H OH Et H Et H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COME	Н	tBu							
CI	Н	₽h	Н	CHO					
CI Ph H OH Ph H Ph H COME  Et CI H COME CI H CI CI COOH  nPr CI H CONH <sub>2</sub> CI H CI CI CONH <sub>M</sub> H Et CI CONHME Et CI Et H CONHMS  H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS  H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO <sub>2</sub> Me Me H NO <sub>2</sub> Me H Me H OH  nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	CI	Et	Н	SO₃H					
Et CI H COMe CI H CI CI COOH  nPr CI H COOH CI H CI CI CONH <sub>2</sub> Ph CI H CONH <sub>2</sub> CI H CI CI CONHMB  H Et CI CONHMB Et CI Et H CONHMS  H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS  H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO <sub>2</sub> Me Me H NO <sub>2</sub> Me H Me H OH  Et Et H OH Et H Et H COME  nPr nPr H COOH	CI	n₽r							
NPT   C  H   COOH   C  H   C  C  CONH <sub>2</sub>	CI	Ph							
Ph	Et	Cl							
H Et CI CONHME ET CI ET H CONHMS H nPr CI CONHMS nPr CI nPr H NHMS H Ph CI NHMS Ph CI Ph H NO2 Me Me H NO2 Me H Me H OH ET ET H OH ET H ET H COME nPr nPr H COME nPr H nPr H COOH	nPr	а							
H	Ph	CI							
H         Ph         Cl         NHMs         Ph         Cl         Ph         H         NO2           Me         Me         H         NO2         Me         H         Me         H         OH           Et         Et         H         OH         Et         H         Et         H         COMe           nPr         nPr         H         COMe         nPr         H         nPr         H         COOH	Н	Εt							
Me         Me         H         NO2         Me         H         Me         H         OH           Et         Et         H         OH         Et         H         Et         H         COMe           nPr         nPr         H         COMe         nPr         H         nPr         H         COOH	Н	nPr		CONHMs					
Et Et H OH Et H Et H COMe nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Н	₽ħ							
nPr nPr H COMe nPr H nPr H COOH	Me								
HET THE COME IN THE STATE OF TH	Et	Εt							
Ph Ph H COOH Ph H Ph H NO <sub>2</sub>	nPr								
	Ph	Ph	Н	COOH	Ph_	H	Ph ——	Н.	NO <sub>2</sub>

[0221]

【表53】

HN-R			
HN ~~	ни	HN~	
HN ~~~	он		HN
	HN	HN O	HN N
HN	,,,,		°
HN ~	HN	HN	F HN N
$\vee$	اعم	HN	, N
HN \	HN	F	HN
ΠΙΝ -	NH	2 HN	HN/\_S
HN	HN	···· }	HN~~o~
<u>~</u>		HN \	HN O
HN	HN	соон	
	HN	HN	HN N
HN	он он	NH <sub>2</sub>	N N
HN	HN \	HN	HN
HM	HN T	HN Me	N= N CI
HN	HN	HN	HN
		'" 📥	LN NA
HN OH	HN		,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,
HN \	HN \	N OH	

### 【0222】 【表54】

-	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
-	Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	H	NO <sub>2</sub>	Et
	Н	Н	i₽r	CHO	Н	iPr	н	CHO	ιPr
	Н	Н	nPr	SO <sub>3</sub> H	Н	nPr	Н	so₃H	nPr
	Н	Н	nBu	Cl	Н	nBu	н	CI	nBu
	Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
	Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	Н	CH <sub>2</sub> OH	Ph
	Εt	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
	iPr	Н	H	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	н	CH <sub>2</sub> NHM	е Н
	nPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	Н
	nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
	tBu	Н	н	COOH	Н	Н	Н	COOH	Н
	Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
	Н	Et	н	CONHMe	Et	Н	Εt	CONHM	
	Н	iPr	н	CONHMs	í₽r	н	iPr	CONHM	
	н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
	Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
	Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	NO <sub>2</sub>	Н
	Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	so₃H
	CI	Et	Н	SO₃H	Et	Н	Et	н	SO <sub>2</sub> NHMe
	Cl	n₽r	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	н	OH
	CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
	Εt	a	н	COMe	Ci	Н	CI	Cl	COOH
	nPr	CI	Н	COOH	CI	н	CI	a	CONH <sub>2</sub>
	₽h	a	H	CONH₂	Cl	Н	CI	Cl	CONHMe
	Н	Et	CI	CONHMe	Et	Cl	Εt	Н	CONHMs
	Н	nPr	Cl	CONHMs	nPr	a	nPr	н	NHMs
	н	Ph	CI	NHMs	₽h	CI	Ph	н	NO <sub>2</sub>
	Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
	Εt	Εt	Н	OH	Et	Н	Εt	Н	COMe
	nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nPr		COOH
	Ph	Ph	Н	COOH	₽h	Н	Ph	Н	$NO_2$
				_					

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	H	ıPr	CHÓ	Н	ıPr	н	CHO	i₽r
H	H	nPr	SO <sub>3</sub> H	н	nPr	н	SO₃H	nPr
н	H	nBu	ci ci	н	nBu	Н	CI	nBu
H	H	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	H	Ph	CH <sub>2</sub> OH	н	₽h	Н	CH <sub>2</sub> OH	₽h
Et	H	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH;	<sub>2</sub> H
ıPr	н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	1e H
nPr	H	н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Н
nBu	H	H	COMe	H	Н	H	COMe	н
tBu	H	Н	COOH	Н	н	Н	COOH	Н
₽h	H	H	CONH <sub>2</sub>	н	Н	Н	CONH:	2 H
Н	Et	н	CONHMe	Et	Н	Et	CONHM	le H
н	iPr	Н	CONHMs	iPr	н	iPr	CONHM	
Н	nPr	н	NHMs	nPr	H	n₽r	NHMs	н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	le H
н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	н	tBu	$NO_2$	Н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
Cl	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	н	Ph	Н	COMe
Εt	a	Н	COMe	CI	Н	CI	CI	COOH
n₽r	a	Н	COOH	a	Н	CI	Cl	CONH <sub>2</sub>
Ph	CI	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	Cl	CI	CONHMe
н	Et	CI	CONHMe	Εt	Cl	Εt	Н	CONHMs
Н	n₽r	CI	CONHMs	n₽r	CI	nPr	Н	NHMs
н	₽h	CI	NHMs	Ph	Cl	₽h	н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	OH.	Εt	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	н	nPr	н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	₽h	Н	Ph	Н	$NO_2$

# 【0224】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
——	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	Н	iPr	CHŌ	Н	iPr	Н	CHO	íPr
н	Н	nPr	so₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	Cl	H	nBu	Н	a	nBu
Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	Н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	н	Н	CH <sub>2</sub> NH	
iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	н	CH <sub>2</sub> NH№	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	
tBu	н	н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH:	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
н	iPr	н	CONHMs	i₽r	н	iPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	t₿u	NO <sub>2</sub>	Н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	so₃H
CI	Et	Н	so₃H	Εt	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHM
Cl	nPr	н	SO₂NHMe	nPr	Н	nPr	Н	ОН
CI	₽h	Н	оH	₽h	Н	₽ħ	н	COMe
Εt	CI	Н	COMe	CI	Н	CI	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	CI	Cl	CONH <sub>2</sub>
Ph	Cl	Н	CONH <sub>2</sub>	a	Н	a	а	CONHM
Н	Et	CI	CONHMe	Εt	CI	Et	Н	CONHM
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	Cl	nPr	н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ρ'n	CI	Ph	Н	$NO_2$
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	он
Et	Et	Н	OH	Εt	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr		COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

[0225]

【表57】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	н	íPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ıPr
H	Н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	so₃H	nPr
H	H	nBu	a	н	nBu	Н	Cl	nBu
н	Н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	₽h	н	CH <sub>2</sub> OH	
Εt	н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	н	CH <sub>2</sub> NH:	
iPr	н	н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	н	н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	
tBu	H	н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH;	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	н	iPr	CONHM	
н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	H	tBu	$NO_2$	н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	so₃H
CI	Et	н	so₃H	Εt	Н	Εt	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	H	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	он	₽h	н	Ph	Н	COMe
Εt	Cl	Н	COMe	Cl	H	CI	a	COOH
nPr	CI	Н	COOH	Cl	Н	CI	CI	CONH <sub>2</sub>
Ph	Cl	Н	CONH <sub>2</sub>	a	н	CI	Cl	CONHMe
H	Et	CI	CONHMe	Et	Cl	Εt	Н	CONHMs
Н	nPr	Cl	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
H	Ph	CI	NHMs	Ph	a	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	н	$NO_2$	Me	Н	Me	Н	OH
Εt	Et	Н	OH	Et	Н	Εt	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	н	nPr		COOH
Ph	Ph	H	COOH	Ph	H	Ph	н	NO <sub>2</sub>

【0226】 【表58】

HN-R			
HN ~	HN \	HN \	HN
HN ~~	óн 	HN \	
HN	HN F		HN \
HN	HN	HN	F HN
$\overline{\cap}$	HN	HN	HN ~ N
HN	NH	HN HN	HN~~S~
HN	HN F	ļ	HN O
HN	HN	HN COOH	HN~O
HN \	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN S	HN Ne	HN N CI
HN	HN		HN
HN	HN	N OH	

[0227]

【表59】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	Н	CHŌ	н	н	Н	CHO
H	H	nPr	н	SO <sub>3</sub> H	н	н	Н	SO <sub>3</sub> H
H	Н	nBu	Н	cĭ	н	н	Н	Cl
H	н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	H	Me	COOH	H	Me	Н	COOH
Et	Ph	H	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ìPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	n₽r	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	Н	₽h	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	₽h	Ph	CH₂CH₂Ph	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н

【0228】 【表60】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	н	н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	CHO	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	SO₃H	н	н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	н	ci	н	н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH2NH2	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	₽h	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ìPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	Ph	tBu	CHO	₽h	tBu	₽h	Н
₽h	CI	Et	Ρħ	so₃H	Et	Ph	Εt	H
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH2NH2	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H H
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н

[0229]

【表61】

						_		
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	CHÔ	н	Н	н	CHO
H	H	nPr	н	SO₃H	н	н	Н	so₃H
н	Н	nBu	Н	ci	н	н	Н	Cl
H	Н	tBu	Н	Br	н	Н	Н	Br
Me	Н	₽h	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	Me	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	$\mathrm{CH_2NHMe}$
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	H	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	ìPr	NHMs	n₽r	ıPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et	₽h	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	H
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH₂OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHM e	Ме	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H H
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH₂Ph	Et	
CH₂Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	H H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H

### 【0230】 【表62】

	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
	Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	н	Н	NO <sub>2</sub>
	H	Н	iPr	н	CHŌ	н	н	Н	CHO
	H	Н	nPr	Н	so₃H	Н	н	н	so₃H
	H	н	nBu	Н	CĪ	н	н	Н	CI
	Н	н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
	Me	н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
	Me	Et	Ph	Me	CH2NH2	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
	Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
	Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
	Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
	Me	tBu	н	Me	COOH	H	Me	Н	COOH
	Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	н	CONH <sub>2</sub>
	Et	н	Et	Εt	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
	Εt	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	1Pr	CONHMs
	ıPr	Н	nPr	iPr	инмs	n₽r	iPr	nPr	NHMs
	nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
	nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
	tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	H
	Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Εt	н
	CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	ηPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
	CH <sub>2</sub> OH	a	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
	CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
	CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	Cl
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	H
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
(	CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHM∈		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H
	CH₂₽h	nPr	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	
(	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	1 COOH	Ph	CH₂CH₂Ph ————	Ph	Н

[0231]

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN
HN	HN	HN	HN
HN~~	HN	HN \	F HN N
	HN	HN F	HN
HN	NH	HN ~	HN/\_S\
HN	HN F	ř	HN O
HN C	HN ~	HN COOH	HN
HN COL	ни	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	ни
HN	HN S	HN Nie	HN N CI
HNOH	HN		The MH
ни	HN	N OH	

#### 【0232】 【表64】

-	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
-	Н	Me		NO <sub>2</sub>	Н	OMe	н
	Н	Et		CHO	Н	OEt	Н
	Н	iPr		so₃H	Н	OiPr	H
	Н	nPr		a	Н	OnPr	
	н	nBu		Br	Н	OBn	Н
	н	tBu		CH <sub>2</sub> OH	Н	OPh	Н
	н	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	SMe	Н
	Me	Н		CH <sub>2</sub> NHMe	Н	SEt	Н
	Et	Н		CH <sub>2</sub> Ph	Н	SiPr	Н
	iPr	Н		COMe	н	SnPr	
	nPr	Н		COOH	н	OCH₂Ch	
	nBu	н		CONH <sub>2</sub>	Н	SCH <sub>2</sub> CH	
	tBu	н		CONHMe	Et	Н	OMe
	Ph	NO <sub>2</sub>		CONHMs	iPr	Н	OEt
	Н	CHŌ		NHMs	nPr	CI	OiPr
	Н	SO <sub>3</sub> H		NHCOMe	nBu	Me	OnPr
	н	cĭ		NO <sub>2</sub>	tBu	Et	OBn
	H	Br		CHO	₽h	nPr	OPh
	Н	CH <sub>2</sub> OH		SO₃H	Et	Ph	SMe
	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Me	SEt
	CI	CH <sub>2</sub> NHMe		он	₽h	Et	SiPr
	CI	CH₂Ph		COMe	CI	nPr	
	Cl	COMe		COOH	a	Ph	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
	Et	COOH		CONH <sub>2</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	
	nPr	CONH <sub>2</sub>		CONHMe	Et	CHO	
	Ph	CONHMe		CONHMs	nPr	SO <sub>3</sub> l	
	Н	CONHMs		NHMs	₽ħ	Cl	OnPr
	Н	NHMs		$NO_2$	Me	Br	SMe
	н	NHCOMe		он	Et	CH <sub>2</sub> C	
	Me	CO <sub>2</sub> H		COMe	nPr	CH <sub>2</sub> N	
	Et	н		COOH	₽h	F	SPh
			_				

R13         R14         R13         R14         R13         R14           H         Me         NO2         H         OMe         H           H         Et         CHO         H         OEt         H           H         Et         CHO         H         OET         H           H         IPT         SO3H         H         OIPT         H           H         nPr         CI         H         OnPr         H           H         nBu         Br         H         OBn         H           H         nBu         Br         H         OPh         H           H         ph         CH₂NH₂         H         SMe         H           Me         H         CH₂NH₂         H         SMe         H           Me         H         CH₂NH₂         H         SMe         H           NPr         H         CNPh         H         SIPr         H         SIPr         H         SIPr         H         SIPr         H         SIPr         H         CNPc         CNPm         N         SIPr         H         CNPc         CNPc         CNPc         CNPc         CNPc </th <th></th> <th></th> <th>K</th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>			K				
H Et CHO H OEt H H IPT SO3H H OIPT H H nPT CI H ONPT H H nPT CI H ONPT H H nBU BT H OBN H H tBU CH2OH H OPN H H PN CH2NH2 H SMMM H MMM H CH2NHMM H SET H IPT H COMM H SNPT H IPT H COMM H SNPT H IPT H COMM H SNPT H IPT H CONH12 H SCH2CH2PN H IBU H CONHM ET H OM PN NO2 CONHMS IPT CI OIPT H CHO NIMMS NPT CI OIPT H CHO NIMMS NPT CI OIPT H CH COMM H SO1PT OPN H CH CH2NHMM N SMMM M ONPT CI NO2 CONHMS IPT CI OIPT H CHO NIMMS NPT CI OIPT H CH CH2OH SO3H ET PN SMMM SME H CH2OH SO3H ET PN SMMM SET CI CH2PN COMM CI CH2NHMM ON SME CI CH2PN COMM CI CH2PN CI COMM CI CONH12 CI COM PN CONHMS NPT SO3H OET CI COMM CI CONH12 CI COM PN CONHMS NPT SO3H OET COMM CONHMS NPT SO3H OET COMM CONHMS NPT SO3H OET COMM COMM SIPT SO3H OET COMM COMM SIPT SO3H OET COMM SIPT SO3H S	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
H Et CHO H OET H H IPT SO3H H OIPT H H nPT CI H ONPT H H nBU Br H OBN H H tBU CH2OH H OPH H H Ph CH2NH2 H SME H ET H CH2PH H SIPT H IPT H COME H SNPT H IPT H COME H SNPT H IPT H CONH2 ET H OME  BBU H CONHMS IPT H OH H CH2OH BBU ME ONPT H CHO NHMS NPT CI OIPT H CH2OH BBU ME ONPT H CH2OH BBU ME ONPT CI OIPT H CH2OH BBU ME SET OBN H CH2OH BBU ME ONPT CI OIPT H CH2OH BBU ME STET OBN H CH2OH BBU ME STET OBN H CH2OH BBU ME STET OBN H CH2OH BBU ME SO2NHME IPT H CH2OH BBU ME STET OBN H CH2OH BBU ME STET OBN CI CH2PH COME CI NPT SNPT CI COME COOH CI Ph OCH2CH2PH CI CH2PH COME CI NPT SNPT CONHME CONHMS NPT SO3H OET CONHMS NPT SO3H	Н	Me	NO <sub>2</sub>	Н	_	OMe	
H iPr SO₃H H OiPr H H nPr CI H OnPr H H nBu Br H OBn H H tBu CH₂OH H OPh H H Ph CH₂NH₂ H SMe H Et H CH₂NHMe H SEt H IPr H COMe H SnPr H  nPr H COMH H SNPr H  nPr H COMH₂ H SCH₂CH₂Ph H  nPr H COMH₂ H SCH₂CH₂Ph H  tBu H CONHMe Et H OMe  Ph NO₂ CONHMs iPr CI OiPr H CHO NHMs nPr CI OiPr H CHO NHMs nPr CI OiPr H CH₂OH SO₃H Et OBn H CH₂OH SO₃H Et SiPr CI CH₂Ph COMe CI nPr SMe  CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr CI CH₂Ph CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr CI CH₂Ph CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr CI CH₂Ph CI COMH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI CH₂Ph CI CH₂Ph CI CH₂Ph CI CH₂Ph CI CH₂Ph CI COME CI nPr SnPr CI OiPr CI COME COHH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI COMH COHH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI COMH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI COMH COHH CI Ph OCH₂CH₂Ph CI CONHMS NPI SO₃H OEt			CHÔ	Н			
H			SO <sub>3</sub> H	Н		OiPr	
H nBu Br H OBn H H tBu CH₂OH H OPh H H Ph CH₂NH₂ H SMe H  Me H CH₂NH₂ H SEt H  Et H CH₂Ph H SiPr H  IPr H COMe H SnPr H  IPr H COMH H OCH₂CH₂Ph H  IBu H CONH₃ H SCH₂CH₂Ph H  IBu H CONHM Et H OMe  Ph NO₂ CONHMS IPr H OEt  H CHO NHMS nPr CI OIPr  H CHO NHMS nPr CI OIPr  H SO₃H NHCOMe nBu Et OBn  H CH₂OH Ph nPr OPh  H CH₂OH Ph nPr OPh  H CH₂OH SO₃H Et Ph SMe  CI CH₂NHME OH Ph Et SIPr  CI CH₂NHME OH Ph Et SIPr  CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr  CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr  CI COME  CONHMS NPr CONHME Et CHO OME  H CH₂OH SO₃H Et CHO OME  CI CH₂Ph COME CI nPr SnPr  CI COME COOH CI Ph OCH₂CH₂Ph  Ph CONHMS NPr SO₃H OEt COME  Et COOH CONH₂ CONHMS NPr SO₃H OEt  H NHMS NPr CONHMS NPr SO₃H OET  CONHMS NPR SO⊞H OET  CONHMS NPR SOET  CONHMS NPR			ci	Н			
H tBu CH₂OH H OPh H H Ph CH₂NH₂ H SMe H Me H CH₂NHMe H SEt H Et H CH₂Ph H SiPr H iPr H COMe H SnPr H iPr H COMe H ScH₂Ph H iBu H CONHMe Et H OMe Ph NO₂ CONHME Et H OMe H SO₃H NHCOME nBu Me OnPr H CH ONPr H SO₃H DPr OPh H CH₂OH SO₃H Et Ph SME H CH₂OH SO₃H Et Ph SME CI CH₂Ph COMe CI nPr SnPr CI COMe COOH CI Ph OCH₂CH₂Ph CONHME ET CHO OME CONHME ET CHO OME CONHME CONHME ET CHO OME H NHMS NO₂ ME Br SME H NHCOME OH ET CH₂NH₂ SIPr	н		Br	Н			
Me			CH <sub>2</sub> OH	Н			
Me         H         CH₂NHMe         H         SEt         H           Et         H         CH₂Ph         H         SiPr         H           IPr         H         COMe         H         SnPr         H           IPr         H         COMe         H         OCH₂CH₂Ph         H           IBU         H         CONHMe         Et         H         OMe           Ph         NO2         CONHMe         IPr         H         OEt           H         CHO         NHMS         NPr         CI         OIPr           H         CHO         NHMS         NPr         CI         OIPr           H         SO₃H         NHCOME         NBu         Me         OnPr           H         CI         NO2         1Bu         Et         OBn         OnPr           H         CH         NO2         1Bu         Et         Ph         SMe           H         CH2OH         SO₃H         Et         Ph         SMe           H         CH2OH         SO₃H         Et         Ph         SMe           CI         CH2NHMe         OH         Ph         Et         SIPr			CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н			
Et         H         CH <sub>2</sub> Ph         H         SIPr         H           IPr         H         COMe         H         SnPr         H           nPr         H         COMe         H         SnPr         H           nPr         H         COOH         H         OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph         H           nBu         H         CONHMS         IPr         H         OMe           Ph         NO <sub>2</sub> CONHMS         IPr         H         OMe           H         CHO         NHMS         nPr         CI         OIPr           H         CHO         NHMS         nPr         CI         OIPr           H         BY         CHO         Ph         nPr         OPr           H         BY         CHO         Ph         nPr         OPr           H         CH <sub>2</sub> OH         SO <sub>2</sub> NHMe         nPr         Me         SET           CI         CH <sub>2</sub> NH         COMe         CI         nPr         SnPr           CI         CH <sub>2</sub> Ph         COMe         CI         nPr         SnPr           CI         CH <sub>2</sub> Ph         COMe         CI         nPr         SO <sub>2</sub> Me <t< td=""><td></td><td></td><td>CH<sub>2</sub>NHMe</td><td>н</td><td></td><td></td><td></td></t<>			CH <sub>2</sub> NHMe	н			
IPT				Н			
nPr         H         COOH         H         OCH2CH3Ph         H           nBu         H         CONH2         H         SCH2CH2Ph         H           tBu         H         CONHMS         Et         H         OMe           Ph         NO2         CONHMS         IPr         H         OEt           H         CHO         NIMS         nPr         CI         OIPr           H         SO3H         NHCOME         nBu         Me         OnPr           H         SO3H         NHCOME         NHCOM			COMe	н			
NBU			COOH	Н			
The content of the			CONH <sub>2</sub>	Н			
Ph         NO₂         CONHMS         IPr         H         OEt           H         CHO         NHMS         nPr         CI         OIPr           H         CHO         NHMS         nPr         CI         OIPr           H         SO₃H         NH         NH         NH         OPR         NH         OPR           H         CH₂OH         SO₃H         Et         Ph         SME         S			CONHMe	Εt			
H CHO NHMS nPr CI OFF H SO3H NHCOME nBu Me OnPr H CI NP2 tBu Et OBn NPr OPh H CH2OH SO3H Et Ph SMe H CH2NH2 SO2NHME nPr Me SEt CI CH2NHME OH Ph Et SIPr CI CH3Ph COME CI nPr SnPr CI COME COOH CI Ph OCH2CH2Ph CI COME COOH CI Ph OCH2CH2Ph CI CONHME ET CHO OME NPr CONH2 CONHME ET CHO OME H CONHMS NPMS Ph CI OnPr H CONHMS NPMS Ph CI OnPr H NHMS NO2 ME Br SME H NHCOME OH ET CH2NH2 SIPr			CONHMs	iPr			
H SO <sub>3</sub> H NHCOMe nBu Me OnFr H Cl NO <sub>2</sub> tBu Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh H CH <sub>2</sub> OH SO <sub>3</sub> H Et Ph SMe H CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe nPr Me SEt Cl CH <sub>3</sub> NHMe OH Ph Et SIPr Cl CH <sub>2</sub> NHMe Cl nPr SnPr Cl COMe COOH Cl Ph OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Cl COMe COOH Cl Ph OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph Ph CONHMe Et CHO OME Ph CONHME TO ONH H CONHMS NHMS Ph Cl OnPr H NHMS NO <sub>2</sub> Me Br SMe H NHCOME OH Et CH <sub>2</sub> OH SEt Me CO <sub>2</sub> H COME nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> SIPr			NHMs	nPr			
H Cl NO2 tBu Et OBn H Br CHO Ph nPr OPh H CH20H SO3H Et Ph SMe H CH2NH2 SO2NHMe nPr Me SEt Cl CH2NHME OH Ph Et SIPr Cl CH2Ph COME Cl nPr SnPr Cl COME COOH Cl Ph OCH2CH2Ph Et COOH CONH2 Cl NO2 SCOME nPr CONH2 CONHME Et CHO OME Ph CONHMS NPr SO3H OEt H NHMS NIO2 ME Br SME H NHCOME OH Et CH2OH SEt NO2 WE			NHCOMe	nBu			
H Br CHO Ph nPr OPh H CH₂OH SO₃H Et Ph SMe H CH₂OH₂ SO₂NHMe nPr Me SEt CI CH₂NHMe OH Ph Et SIPr CI CH₂NHMe OH Ph Et SIPr CI COMe COH CI Ph OCH₂CH₂Ph Et COOH CONH₂ CI NO₂ SCOMe Ph CONH₂ CONHME Et CHO OME Ph CONHME CONHMS nPr SO₃H OEt Ph CONHMS NHMS Ph CI OnPr H NHMS NO₂ Me Br SMe H NHCOME OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COME COPP	н		NO <sub>2</sub>	tBu			
H	н		CHO	Ph			
H CH₂NH₂ SO₂NHMe nPr Me SEt CI CH₂NHMe OH Ph Et SIPr CI CH₂Ph COMe CI nPr SnPr CI COMe COOH CI Ph OCH₂CH₂Ph Et COOH CONH₂ CI NO₂ SCOMe nPr CONH₂ CONHME Et CHO OMe Ph CONHME CONHME nPr SO₃H OEt H CONHMS NHMS Ph CI OnPr H NHMS NO₂ Me Br SMe H NHCOME OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COME nPr CH₂NH₂ SIPr	Н	CH2OH	so₃H	Et			
CI CH2NHMe OH Ph Et SIPT CI CH3Ph COMe CI nPr SnPr CI COMe COOH CI Ph OCH2CH2Ph Et COOH CONH2 CI NO2 SCOMe nPr CONH2 CONHME Et CHO OME Ph CONHMB CONHMS nPr SO3H OEt H CONHMS NIHMS Ph CI OnPr H NHMS NO2 Me Br SME H NHCOME OH Et CH2OH SEt Me CO2H COME NPr CH2NH2 SIPT	н		SO <sub>2</sub> NHMe	nPr			
CI CH2Ph COMe CI nPr SnPr CI CI COMe CI CI COME CI CI COME CI	CI		OH	Ph			
CI COMe COOH CI Ph OCH2CH2Ph EEL COOH CONH2 CI NO2 SCOME  NPT CONH42 CONHMB EL CHO OME  Ph CONHMB CONHMS NPT SO3H OEL  H CONHMS NHMS Ph CI ONPT  H NHMS NO2 ME BT SME  H NHCOME OH EL CH2OH SEL  ME CO2H COME NPT CH2NH2 SIPT	Cl		COMe	CI			
CONHM2	CI		COOH	Cl			
Ph         CONHMe         CONHMS         nPr         SO₃H         OEt           H         CONHMS         NHMS         Ph         Cl         OnPr           H         NHMS         NO₂         Me         Br         SMe           H         NHCOMe         OH         Et         CH₂OH         SEt           Me         CO₂H         COMe         nPr         CH₂NH₂         SiPr	Et	COOH	CONH <sub>2</sub>				-
H CONHIMS NHMS Fh Cl OnPr H NHMS NO2 Me Br SMe H NHCOME OH Et CH₂OH SEt Me CO₂H COME nPr CH₂NH₂ SiPr	n₽r	CONH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt			
H NHMs NO2 Me Br SMe H NHCOMe OH Et CH2OH SEt Me CO2H COMe nPr CH2NH2 SIPr	Ph	CONHMe	CONHMs	nPr			
H NHCOME OH Et CH <sub>2</sub> OH SEt  Me CO <sub>2</sub> H COME nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> SiPr	н	CONHMs	NHMs	₽h			
Me CO <sub>2</sub> H COMe nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> SiPr	Н	NHMs	NO <sub>2</sub>				
Me CO2H COM	Н	NHCOMe	ОН				
	Me	CO <sub>2</sub> H					
			COOH	Ph	_	F	SPh

# 【0234】

## AR O O I

_	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
-	Н.	Me	 NO <sub>2</sub>	Н	 OMe	н
	Н	Et	CHÖ	Н	OEt	Н
	Н	iPr	SO <sub>3</sub> H	Н	OiPr	н
	Н	nPr	ci	н	OnPr	Н
	Н	nBu	Br	Н	OBn	н
	н	tBu	CH <sub>2</sub> OH	н	OPh	Н
	н	Ph	CH2NH2	Н	SMe	H
	Me	н	CH₂NHMe	Н	SEt	Н
	Et	н	CH <sub>2</sub> Ph	Н	SiPr	Н
	iPr	н	COMe	Н	SnPr	Н
	nPr	н	COOH	Н	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	
	nBu	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pi	
	tBu	·H	CONHMe	Εt	н	OMe
	Ph	NO <sub>2</sub>	CONHMs	iPr	Н	OEt
	Н	CHO	NHMs	nPr	CI	OiPr
	Н	SO <sub>3</sub> H	NHCOMe	nBu	Me	OnPr
	н	ci	NO <sub>2</sub>	tBu	Et	OBn
	н	Br	CHO	₽h	nPr	OPh
	н	CH2OH	SO <sub>3</sub> H	Εt	Ph	SMe
	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	SO₂NHMe	nPr	Me	SEt
	CI	CH <sub>2</sub> NHMe	OH	Ph	Et	SiPr
	a	CH₂Ph	COMe	CI	nPr	SnPr
	CI	COMe	COOH	CI	Ph	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
	Εt	COOH	CONH <sub>2</sub>	CI	NO <sub>2</sub>	SCOMe
	nPr	CONH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CHO	OMe
	Ph	CONHMe	CONHMs	nPr	SO₃H	OEt
	н	CONHMs	NHMs	Ph	Cl	OnPr
	н	NHMs	NO <sub>2</sub>	Me	Br	SMe
	н	NHCOMe	OH	Εt	CH₂OH	SEt
	Me	CO₂H	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	SiPr
	Et	н	 COOH	Ph	 F	SPh

[0235]

【表67】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Me	NO <sub>2</sub>	Н		OMe	н
Н	Et	CHŌ	Н		OEt	н
н	iPr	SO₃H	Н		OiPr	н
Н	nPr	CÎ	Н		OnPr	Н
н	nBu	₿r	H		OBn	Н
H	tBu	CH <sub>2</sub> OH	Н		OPh	н
н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		SMe	Н
Me	н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		SEt	Н
Et	Н	CH₂Ph	H		SiPr	Н
iPr	H	COMe	Н		SnPr	Н
nPr	H	COOH	Н			
nBu	H	CONH <sub>2</sub>	Н		SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	
tBu	Н	CONHMe	Et		H	OMe
Ph	NO <sub>2</sub>	CONHMs	iPr		Н	OEt
Н	CHÔ	NHMs	nPr		Cl	Oi₽r
H	SO <sub>3</sub> H	NHCOMe	nBu		Me	OnPr
н	CI	NO <sub>2</sub>	tBu		Εt	OBn
Н	Br	CHO	Ph		nPr	OPh
Н	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	Εt		Ph	SMe
н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		Me	SEt
CI	CH <sub>2</sub> NHMe	он	₽h		Et	SiPr
Cl	CĤ₂Ph	COMe	CI		n₽r	SnPr
Cl	COMe	COOH	CI		₽h	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Et	COOH	CONH <sub>2</sub>	Çl		NO <sub>2</sub>	SCOMe
nPr	CONH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		CHO	OMe
Ρħ	CONHMe	CONHMs	n₽r		SO₃H	OEt
Н	CONHMs	NHMs	Ph		CI	OnPr
Н	NHMs	NO <sub>2</sub>	Me		Br	SMe
н	NHCOMe	OH	Et		CH <sub>2</sub> OH	SEt
Me	CO <sub>2</sub> H	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	SiPr
Et	н	COOH	Ph	_	F	SPh
		_				

【0236】 【表68】

HN-R
HN OH HN OH
HN N N N
HN HN
HN HN F HN N
HN OF HN N
HN NH <sub>2</sub> HN S
HN F HN O
HN COOH HN
HN OH HN NH2 HN
HN N CI
HN HN N
HN H
[0237]

## 【表69】

R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>
Н	Me
н	Et
н	iPr
Н	nPr
H	nBu
Me	tBu
Me	₽h
Me	CH <sub>2</sub> OH
Me	CH <sub>2</sub> OMe
Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	Me
Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Et	CH₂NHMe
Εt	CH <sub>2</sub> Ph
i₽r	CH <sub>2</sub> Ph
n₽r	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
nBu	Н
tBu	Me
Ph	Н
CH <sub>2</sub> OH	Me
CH <sub>2</sub> OH	Et
CH₂OMe	nPr
CH <sub>2</sub> OMe	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr
$CH_2NH_2$	₽h
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> NHMe	€t
$CH_2Ph$	nPr
CH₂Ph	Ph
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> Ph
_	

### 【0238】 【表70】

R<sup>II</sup> HN OH Me

N		Me
R12 N	T,	`O´ \ Me
	0	
	R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>
•	Н	Me
	H	Et
	н	iPr
	н	nPr
	H	nBu
	Me	tBu
	Me	Ph
	Me	CH₂OH
	Me	CH <sub>2</sub> OMe
	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
	Me	Me
	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
	Et	CH <sub>2</sub> NHMe
	Et	CH <sub>2</sub> Ph
	iPr	CH <sub>2</sub> Ph
	nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
	nBu	Н
	tBu	Me
	Ph	Н
	CH <sub>2</sub> OH	Me
	CH <sub>2</sub> OH	Et
	CH <sub>2</sub> OMe	nPr
	CH <sub>2</sub> OMe	Ph
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me
	CH <sub>2</sub> NHMe	Et -Dr
	CH₂Ph	nPr Ph
	CH <sub>2</sub> Ph CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	

[0239]

表71】

R<sup>II</sup> HN OH ME

0	
R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>
Н	Me
н	Et
н	iPr
н	nPr
Н	nBu
Me	tBu
Me	₽ħ
Me	CH₂OH
Me	CH₂OMe
Me	$CH_2NH_2$
Me	Me
Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Et	CH₂NHMe
Et	CH₂Ph
iPr	CH₂Ph
nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
nBu	Н
tBu	Me
Ph	Н
CH <sub>2</sub> OH	Me
CH <sub>2</sub> OH	Et
CH <sub>2</sub> OMe	nPr
CH <sub>2</sub> OMe	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> NHMe	Et
CH <sub>2</sub> Ph	nPr
CH <sub>2</sub> Ph	Ph
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> Ph

【0240】 【表72】

"J	O Me	
R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>	
Н	Me	
Н	Et	
Н	iPr	
Н	nPr	
Н	nBu	
Me	tBu	
Me	₽h	
Me	CH <sub>2</sub> OH	
Me	CH <sub>2</sub> OMe	
Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
Me	Me	
Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
Et	CH <sub>2</sub> NHMe	
Et	CH <sub>2</sub> Ph	
iPr	CH <sub>2</sub> Ph	
nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	
nBu	Н	
tBu	Me	
Ph	Н	
CH <sub>2</sub> OH	Me	
CH <sub>2</sub> OH	Εt	
CH₂OMe	nPr	
CH <sub>2</sub> OMe	Ph	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	
CH <sub>2</sub> NHMe	Εt	
CH₂Ph	nPr	
CH <sub>2</sub> Ph	₽h	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> Ph	
		٠.

[0241]

HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN N
HN		HN	HN N N
HN	HN F		I
HN	HN	HN	F HN N
$\sim$	HN	HN F	HN ~ N
HN~	····	. 11 -1	HN S
HN	HN	HN	HN O.
HN \	ни	HN COOH	HN~O
HN ~	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN \	HN N CI
HNOH	HN		HN
HN	HN	N OH	

## 【0242】 【表74】

R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>
Н	Me
н	Et
H	ìPr
H	nPr
н	nBu
Me	tBu
Me	Ph
Me	CH <sub>2</sub> OH
Me	CH <sub>2</sub> OMe
Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	Me
Et	CH2NH2
Et	CH <sub>2</sub> NHMe
Et	CH₂Ph
iPr	CH <sub>2</sub> Ph
nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
nBu	Н
t⊞u	Me
Ph	н
CH <sub>2</sub> OH	Me
CH <sub>2</sub> OH	Et
CH <sub>2</sub> OMe	n₽r
CH <sub>2</sub> OMe	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me
CH₂NHMe	Εt
CH₂Ph	nPr
CH₂Ph	Ph
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> Ph

[0243]

[0244]

【表76】

R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>
Н	Me
Н	Εt
Н	iPr
Н	nPr
н	nBu
Me	tBu
Me	₽h
Me	CH <sub>2</sub> OH
Me	CH <sub>2</sub> OMe
Me	$CH_2NH_2$
Me	Me
Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Et	CH₂NHMe
Et	CH <sub>2</sub> Ph
iPr	CH₂Ph
nPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
nBu	н
tBu	Me
Ph	н
CH <sub>2</sub> OH	Me
CH <sub>2</sub> OH	Et
CH <sub>2</sub> OMe	nPr
CH <sub>2</sub> OMe	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me
CH <sub>2</sub> NHMe	Et
CH <sub>2</sub> Ph	nPr
CH <sub>2</sub> Ph	Ph
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	CH₂Ph

【0246】 【表78】

HN-R			
HN	min I	ни	HN N
HN	11 -1	HN^O	HN
HN	HN	HN \	
HN	HN CI	HN \	F HN O
HN	HN	F	HN N
$\cap$	HN NH2	HN I	HN O
HN	HN	HN COOH	HN O
HN	ſ`_ſ <sup>F</sup>		
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN \	HN N CI
ни	HN		HN NH
ÓН HN	HN	N OH	

【表79】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	н	н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	н	сно	н	н	Н	CHO
H	H	nPr	Н	SO₃H	н	н	Н	so₃H
H	H	nBu	н	Cl	н	н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	cH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Εt	CONH <sub>2</sub>	H	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Εt	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	н	ıPr	Et	CONHMs	iPr	Et	í₽r	CONHMs
íPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Εt	₽h	so₃H	Εt	₽h	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	Cl	CH₂OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	h COOH	Ph ——	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph_	Н
	$I \cap$	2 1	Q					

【0248】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	,	R <sup>11</sup>	R¹3	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н		Н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	ıPr	Н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
Н	Н	nPr	н	so₃H	Н		Н	Н	so₃H
Н	Н	nBu	Н	Ci	Н		Н	Н	CI
H	Н	tBu	Н	Br	Н		Н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	$CH_2NH_2$
Me	iPr	H	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Ме	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н		Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	₽h	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Εt	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Εt	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Εt	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOME
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt		Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ρh		CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH2NH2	CONHMs	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н.
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Fh	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph		H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

[0249]

【表81】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	 Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	снô	Н	н	Н	CHO
н	Н	nPr	H	so₃H	Н	Н	Н	so₃H
н	н	nBu	н	ď	Н	Н	Н	Cl
Н	Н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Ме	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Ме	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Ме	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	íPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iΡr	CONHMs
ıPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ıPr	n₽r	NHMs
nPr	Н	ոՑս	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	ИНСОМВ
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	t₿u	₽h	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	Ci	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ρh	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	H
CH2CH2Ph	Ph	Ph	CH₂CH₂PI	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н

#### 【0250】 【表82】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>1 4</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R¹4
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	Н	CHO	Н	Н	н	CHO
H	н	nPr	Н	SO <sub>3</sub> H	н	Н	н	SO₃H
H	Н	nBu	Н	ci	Н	Н	Н	CI
н	н	tBu	н	Br	н	Н	Н	Br
Me	н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	$CH_2NH_2$
Me	íPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	H	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	₽h	SO₃H	€t	Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH₂OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	H
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н
		$\frac{1}{2}$ 5	1					
	1	, 20	- 1					

【表83】

HN-R			
HN ~	DIN ]	HN~	HN
HN ~~	óн	ни	
HN	HN	~ ~ ~ ~ ~ ~	HN \
HN	ни	HN	F HN N
$\sim$	HN	HN F	HN N
HN	NH	HN \	HN~~S~
HN	HN F	· }	HN~~O~
HN ~	HN V	HN COOH	HN~OC
	HN	HN	HN
HN	óн	ŇH₂	ſ. N
HN /	HN	HN HN Me	HN N CI
HN	HN J	HN	HN N
HN	HN		HN N
ни О	HN	HN OH	_

【0252】 【表84】

			R	•					
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>1</sup>	1	R¹3	R <sup>14</sup>
н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Ή		Н	NO <sub>2</sub>
H	н	iPr	н	CHŌ	н	۲		Н	CHO
H	н	nPr	Н	SO₃H	н	ŀ		Н	SO₃H
Н	н	nBu	Н	a	Н	1-		Н	Cl
Н	н	tBu	н	Br	н	ŀ		Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH₂OH	Н	М		Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH2NH2	н	М		Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	М		Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	M		Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	M		н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	M		Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		t	н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		t	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		t	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr		Pr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		Pr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		∃u	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		3u	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt		h	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		<sub>2</sub> OH	nPr	н
CH₂OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		<sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl		OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI		OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl		NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		2NH2	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽ħ		2NH <sub>2</sub>	Ph	H
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me		NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et		l <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr		i₂Ph	nPr	H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	1 COOH	Ph	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н
	(0	2 5	3						

### 【表85】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	Н	SO₃H	Н	н	Н	so₃H
H	н	nBu	Н	ci	Н	Н	Н	CI
Н	Н	tBu	Н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Εt	Et	CONHMe	Et	Εt	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Εt	iPr	CONHMs
īPr	Н	n₽r	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHÖ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH₂OM e	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	$CH_2NH_2$	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Ме	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH₂Ph	ОH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH₂Ph	nPr	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н
			-					

### 【0254】 【表86】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	Н		Н	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	iPr	Н	CHO	· H		Н	Н	CHO
н	Н	nPr	Н	SO₃H	Н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	Н	Cl	Н		Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	H		Н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	$CH_2NH_2$	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Εt	iPr	CONHMs
íPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	₽h	tBu	CHO	Ph		tBu	₽h	Н
Ph	Cl	Et	Ph	so₃H	Εt		Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	a	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	₽h	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		$CH_2NH_2$	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Ме	н
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	· ·	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

[0255]

【表87】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	Н	CHO	Н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	н	so₃H	н	н	н	SO₃H
Н	Н	nBu	н	CI	н	н	Н	Cl
Н	Н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	۳h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	$CH_2NH_2$
Me	i₽r	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Εt	н	CONH <sub>2</sub>
Et	H	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	íPr	Εt	۱Pr	CONHMs
iPr	н	n₽r	íPr	NHMs	nPr	ιPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ρh	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Εt	Ph	so₃H	Εt	₽h	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH2OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH₂	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽ħ	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Εŧ	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
	<b>I</b>	0 [						

【0256】

HN-R			
HN	HN OH	ни	HN N
HN		HN	
HN	HN	HN ~	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,
HN	HN		F HN N
$\Box$	HN	HN	HN ~ N J
HN	, Ni	HN ~	HN~~S~
HN	HN F	·	HNO
HN \	HN J	ни соон	HN O
HN	HNOH	F HN NH2	HN
HN	HN	HN \	HN
ни	HN S	HN -Me	HN N CI
ни	HN		HN N
HN J	HN	N OH	
0	2 5 7]		

HN H
HN HN F HN S  HN F HN S  CI
HN HN F HN S  HN S
HN HN S  HN S  HN S  HN O  HN
HN HN HN O HN O HN O HN O HN O HN O HN
HN HN COOH HN O HN
HN H
HN HN HN HN HN N CI
HN HN Me
HN Y Y LIM
HN OH HN N OH

### 【0258】 【表90】

HN-R		
HN-Me	HN A	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN	$\triangle$	óн
ни 🔷	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN \	HN \	····   • • • • • • • • • • • • • • • • •
ни	····	HN Me
ни	HN	HN S HN
HN	HN	HN~~°
HN	HN	HN O HN
ни	HN	HN NH HN S
HN OH	HN	HN O HN O

		1416	
HN-R			4
HN ~ F	HN NH2	HN	HN CI
HN F	HN	MeHN HN	HN
HN	CO <sub>2</sub> H	NHCH₂P	h Me-N-Me
HN F	HN CO₂M	e HN NH	AC OMe
HN NH <sub>2</sub>	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN HN	HN HN
HN OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO₂E	t Ph
HN	HN	NH <sub>2</sub> CN	HN
HN OH	Me O	HN	HN
HN OH OH	OCF <sub>3</sub>	HN	SH HN

#### 【0260】 【表92】

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	ОМе
CH₂OH	NHCOOEt	HNOMe
COCH3	HN	HN OMe
HN	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN	HN OH	HN COMe
HN \\	OH Me	HN Br
HN CCO	OH Br	HN H

【表93】

	100	
HN-R		
Me HN	HN	HN
HN.N.	HN	HN
HN	HN ~~ N	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HN	O2 OH	HN
HN N	HN H	HN~N
HN N	HN	HN
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN~~o	HN	HN CI
HN O		CI

【0262】 【表94】

HN-R			
HN	HN	HN N	HN N N
HN N-N	HN N	HN	HN
HN N	HN	HN	HN~\N
HN NS	HN N	HN	· / ,
HN N CI	HN CI	HN N NH	HN
N-J		HN	HN N
HN	HN N	r v	HN
HN N	HN JO	HN~~	
HN TO	HN N	HN N-S	
HN	HN S	HN SH	HN N
10	2631		

【表95】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN \	HN N
HN	HN	HN	HN N N
HN	F	ни	
HN	HN	HN	F HN
HN~	HN NI	√ F	HN S
HN	HN	HN	HN ~~~ O~
HN ~	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HN	.F HN	HN
$\bigcap$	ÓH HN	HN NH2	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	LN,
HN OH	HN		HN
HN	HN	NOH	

【0264】 【表96】

HN-R			
HN	HN OH	ни	HN N
HN	HN C	HN O	HN N N
HN	F	HN ~	
HN \	HN CI	HN	F HN
HN	HN NH	2 F	HN S
HN ~	HN	HN	HN O
HN	HN	ни соон	HN O
HN	HN	HN	HN
HIN O	óн	HN NH2	HN
HN	HN	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	TN
ни	HN		HN NH
HN \	ни	NOH	

【表97】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~	ни
HN	HN O	HN	
HN	HN	HN	0
HN	C CI	HN	F HN
HN	HN		HN S
HN	HN F.	HN	HN O
HN	HN J	ни соон	HN O
HN	HNOH	F HN	HN
HN	HN	NH <sub>2</sub>	HN
HN L	Ö	HN Me	HN N CI
	HN	HN	HN
HN OH	HN	N	ď
Ö		фн	

【0266】 【表98】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN \	HN N
HN	HN C	HN	HN N N
HN	HN	HN	·F HN
HN	CI	HN^C	HN N
HN	HN		HN S
HN	HN F	HN	HN ~~ O~
HN	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HN	HN NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
ни	HN	HN	HN N
ни	HN	N OH	J

【表99】

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN
HN	HN	HN	HN N N
HN	F	ни	
HN	HN	HN \	-F HN
HN	HN	l ✓ F	HN N
····	HN	HN F	HN O.
HN	F	HN \	HN O
HN	HN	.F соон	N.
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
1	°	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N
HN OH	HN		HN
HN	HN \	NOH	

【0268】 【表100】

HN-R			
НИ	HN OH	HN \	HN
HN		HN O	HN N N
HN	HN F	HN	, ,
HN	HN	HN \	F HN
HN	HN N⊦	√_F 1>	HN S
HN	ни	HN F	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN O
HN	HN	F HN	HN
HN \	ÓH HN	HN NH2	HN
1		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N N
HN OH	HN	N	···· 8
	TIN	он	

【表101】

HNR			
ни	HN OH	ни	HN N
HN		HN^	HN
HN \	HN F	HN~~	·""
HN	HN CI		F HN N
. D	HN C	HN	HN N
HN~~	NI NI	HN	HN~~S~
HN	HN F	į.	HN O
HN	HN	ни соон	HN
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN S	HN	HN N CI
ни	HN		HN N
ни	HN	N OH	

【0270】 【表102】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN N
HN ~	HN	HN	HN N N
HN	HN F	HN~~	
HN		HN ()	HN NO
HN	HN	. 11 //	HN S.
HN	HN F.	HN	HN O
HN	ни	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	HN J	HN
		HN NH2	HN N
HN HN	8	HN Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN	N	ď
	1,	о́н	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	ни
НИ	11 -11	HN	HN N N N
HN	HN		,
HN	HN	HN \	F HN N
	HN	HN C	ни ~ Л
HN	NH:	2 HN	HN~~S~
HN~	HN	TIN J	HN~~O~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N C
HN	HN		HN~N
HN OH	HN	N OH	

#### 【0272】 【表104】

HN-R	<del></del>	_	
HN/~/	HN \	ни	HN N
HN	он	ни^О	HN N N
HN	HN F	HN ~~	/
HN	HN CI	HN C	F HN O
HN ~	HN	Ų√ <sub>F</sub>	HN N
····	HN	2 HN	HN S
HN	F	HN \	HN O
HN \	HN	- соон Г	N,
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN \		HN
1		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N N
HN OH	HN		HN~N
HN	ни	ИОН	

【表105】

HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN N
HN		HN	HN N N
HN	HN	ни	1
HN	HN	ار اا	F HN O
HN~	HN	Ų, k	HN N
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN Y	HN O
HN ~	HN	HN COOH	HN O
HN	HN OH	HN	HN
HN C		HN H2	HN
ни	HN ~	HN-Me	HN N CI
HN	HN S	HN	HN N
ни	HN	N OH	Ŭ

【0274】 【表106】

HN -R			
HN ~	HN OH	ни	HN N
HN		ни	HN N
HN	HN F	HN ~	
HN	HN CI	HN \	F HN
HN	HN NH	, (°	HN N
HN ~	HN	* HN F	HN O
HN ~	HN	HN COOH	HN~°
HN	HN	HN NH2	HN
HN ~	HN \	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
ни	HN \	HN	HN N
HN OH	HN	N OH	

HN-R			
ни	ни	HN	HN
HN	HN O	HN	HN N N
HN	HN F	HN	. F HN N
HN	CI	HN^C	HN N
HN	HN	له لا .	HN S
HN	HN F	HN	HN~~O~
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	.F	HN
HN \	LIN C	NH <sub>2</sub>	HN
HN	ï	HN Me	HN N CI
	HN	HN	N N
HN OH	HN	N	ď
Ö		о́н	

【0276】 【表108】

HN-R			
HN ~	1464	HN~	HN
HN	ا د الا	HN^	HN N N
HN	HN F	ни	!
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN	Ų√ <sub>F</sub>	HN N
	HN NH2	HN	HN O
HN	HN F	HN COOH	HN~~°
HN	ſ <b>~</b>	(COOR	
HN \	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN J	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN \	HN N CI
ни	HN		HN N
о́н ни О́	HN	N OH	· ·

HN-R			
HN ^	HN ~	ни	HN N
HN	óн Г	HN \	
HN \	HN F		HN TN
HN	HN	HN	F HN N
$\sim$	HN	HN F	HN N
HN	ſ^\N+		HN~~S~
HN ~	HN F.	HN	HN O
HN	HN	ни соон	HN O
HN	HN	F HN	HN
		NH₂ HN	HN
HN	HN	HN Me	N= CI
HN	HN \	HN	HN
HNOH	HN		ни Ли
HN	ни	N OH	

#### 【0278】 【表110】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN N
HN	HN	HN	HN
HN~	HN	HN \\	F HN N
	HN	HN F	HN
HN~~	HN	HN F	HN~~S~
HN ~	HN F	HN COOH	HN O
HN~~	HN	F	HN
HN	óн Г	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N CI
HN \	HN	HN	hv~vy
HN OH	ни	N OH	ď
·			

【表111】

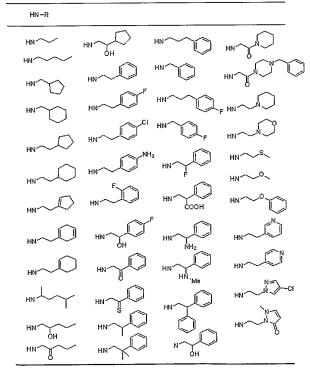
HN-R			
HN ~	rua j	HN~~	ни
HN	اء اا	HN^()	
HN	HN F	HN ~~	
HN	HN	HN (	F HN
HN	HN NH2	V F	HN N
HN \	ни	HN F	HN O
HN	HN	HN COOH	ни
	HN \	HN \	HN N
HN~~	óн	NH <sub>2</sub>	HN
HN \	HN	HN HN Me	N=>_cı
HN	HN	HN	HN
HNOH	HN		HN
HN	HN	N OH	

【0280】 【表112】

HN-R			
HN ~	HN OH	ни~	HN
HN		HN \	HN N N
HN	HN	HN~~	····
HN	HN CI	HN \	F HN NO
HN	ни	V ← F	HN N
····	HN NH2	HN	HN S
HN	F	HN \	HN
HN	HN F	Соон	N.
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN \	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
	HN	HN	HN N
HNOH	HN		,,,,
HN	ни	фн	

HN-R			
HN	ни ОН	HN~	HN N
HN		HN	HN N
HN \	HN F	HN~~	1
HN	HN	HN \	F HN O
HN ~	HN N⊦	Ų, F	HN N
HN CO	HN	HN F	HN O
HN ~	HN	HN COOH	HN~°C
HN	HNOH	F HN NH <sub>2</sub>	HN
HN \	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN	HN N CI
HNOH	HN		HN
HN	HN \	N OH	

# 【0282】 【表114】



【表115】

HN-R		-	
HN	HN OH	HN ~	HN N
HN	HN O	ни	
HN	F	HN ~	, C
HN	HN	HN \	F HN
HN	HN N	√ F	HN N
HN \	ни	HN F	HN O
$\bigcap$	HN F	HN COOH	HN
HN		.F	
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN \	HN S	HN \	HN N CI
ни ~	HN S		TW NH
ни√он	HN	N OH	ĺ

# 【0284】 【表116】

Me Et H Me iPr H Me nPr Me Me nBu E Me tBu iP Et Me PI iPr Et H nPr iPr M	OMe H $\mathrm{CH_2NH2}$ OEt H $\mathrm{CH_2NHM0}$ COCF <sub>3</sub> H $\mathrm{CH_2Ph}$
Me nPr Mi Me nBu E Me tBu iP Et Me PI iPr Et H	OEt H CH2NHMe COCF3 H CH2Ph
Me nBu E Me tBu iP Et Me PI iPr Et H	. OCF <sub>3</sub> H CH₂Ph
Me tBu iP Et Me Pl iPr Et H	
Et Me Pl iPr Et H	
iPr Et H	
nPr iPr M	
nBu nPr E	
tBu nBu iF	
OMe H	
OEt Me	
OiPr Et H	
OPh iPr CH <sub>2</sub>	
SEt H CH <sub>2</sub> I	
SiPr Me CH <sub>2</sub> N	
NH₂ H CH	
NHMe Me CH <sub>2</sub> C	
NHEt Ph CO	
NHPh H CO	
CI Me CO	NH <sub>2</sub> H CHO Br
CI Et CON	HMe H SO₃H Br
CI Ph CON	IHMs Me SO₂NHMe Br
Me CI NH	Ms Me OH Br
Et CI NHO	OMe Me CI NHMs
Ph Cl N	D <sub>2</sub> Me CINHCOMe
Br Me Ch	HO Et CINO <sub>2</sub>
Br Cl SC	o <sub>s</sub> H Et Br CHO
Me Br SO <sub>2</sub> h	√1HMe Et Br SO₃H
CI Br C	H Et Br SO <sub>2</sub> NHMe

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me	Et -	н	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Εt	OCF <sub>3</sub>	H CH <sub>2</sub> Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Εt	Me	₽h	OiPr	Me COMe
í₽r	Et	Н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	$NH_2$	Et CONHMs
OMe	Н	н	NHMe	Et NHMs
0Et	Me	н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	н	NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh	iPr	CH <sub>2</sub> OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH <sub>2</sub> NH2	Et	iPr SO₃H
SiPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	ìPr	iPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub>	н	CH₂Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH2CH2Ph	Н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	H	COOH	н	NO₂ CI
Cl	Me	CONH <sub>2</sub>	Н	CHO Br
a	Et	CONHMe	Н	so₃H Br
Cl	₽ħ	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	C1	NHMs	Me	OH Br
Et	Ci	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO <sub>2</sub>	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO <sub>2</sub>
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO <sub>2</sub> NHMe	Et	Br SO₃H
a	Br	OH	Et	Br SO₂NHMe

#### 【0286】 【表118】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me	Et	Н —	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	Н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nBu	Et	OCF <sub>3</sub>	H CH₂Pħ
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Et	Me	₽h	OiPr	Me COMe
iPr	Et	н	₽h	Me COOH
nPr	ıPr	Me	SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	$NH_2$	Et CONHMs
OMe	H	Н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	н	NHEt	Et NHCOMe
OıPr	Et	Н	NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh	ìPr	CH <sub>2</sub> OH	Me	iPr CHO
SEt	н	CH <sub>2</sub> NH2	Et	iPr SO₃H
SiPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	i₽r	íPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub>	н	CH₂Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Н	NHMs Cl
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO <sub>2</sub> CI
a	Me	CONH <sub>2</sub>	н	CHO Br
CI	Et	CONHMe	H	SO₃H Br
Ci	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO <sub>2</sub>	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO <sub>2</sub>
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO <sub>2</sub> NHMe	Et	Br SO₃H
a	Br	он	Et	Br SO <sub>2</sub> NHMe

# 【表119】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me		Н	OH	H CH₂OH
Me	iPr	н	OMe	H CH <sub>2</sub> NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF <sub>3</sub>	H CH₂Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Et	Me	Ph	OıPr	Me COMe
i₽r	Et	Н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	1Pr	$NH_2$	Et CONHMs
OMe	Н	н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	Н	NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh	iPr	CH <sub>2</sub> OH	Me	iPr CHO
SEt	н	CH <sub>2</sub> NH2	Et	iPr SO₃H
SıPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	iPr	iPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub>	Н	CH₂Ph	н	iPr OH
NHMe	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	н	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO₂ CI
Cl	Me	CONH <sub>2</sub>	Н	CHO Br
a	Et	CONHMe	Н	so₃H Br
Cl	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	Cl	NHCOMe	Me	CI NHMs
₽h	CI	NO <sub>2</sub>	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO <sub>2</sub>
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO₃H
CI	Br	OH	Et	Br SO₂NHMe

# 【0288】 【表120】

R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me Et	н он	H CH <sub>2</sub> OH
Me iPr	H OMe	H CH₂NH2
Me nPr	Me OEt	H CH₂NHMe
Me nBu	Et OCF <sub>3</sub>	H CH <sub>2</sub> Ph
Me tBu	ıPr OnPr	Me CH₂CH₂Ph
Et Me	Ph OiPr	Me COMe
iPr Et	H Ph	ме соон
nPr iPr	Me SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu nPr	Et SiPr	Me CONHMe
tBu nBu	iPr NH₂	Et CONHMs
OMe H	H NHMe	Et NHMs
OEt Me	H NHEt	Et NHCOMe
OiPr Et	H NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh iPr	CH <sub>2</sub> OH Me	iPr CHO
SEt H	CH <sub>2</sub> NH2 Et	iPr SO₃H
SiPr Me	CH₂NHMe iPr	iPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub> H	CH₂Ph H	iPr OH
NHMe Me	CH₂CH₂Ph H	NHMs CI
NHEt Ph	COMe H	NHCOMe CI
NHPh H	соон н	NO <sub>2</sub> CI
Cl Me	CONH <sub>2</sub> H	CHO Br
Cl Et	CONHMe H	SO₃H Br
CI Ph	CONHMs Me	SO <sub>2</sub> NHMe Br
Me CI	NHMs Me	OH Br
Et Cl	NHCOMe Me	CI NHMs
Ph Cl	NO <sub>2</sub> Me	CI NHCOMe
Br Me	CHO Et	CI NO <sub>2</sub>
Br Cl	SO₃H Et	Br CHO
Me Br	SO₂NHMe Et	Br SO₃H
CI Br	OH Et	Br SO <sub>2</sub> NHMe

【表121】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me	Et	Н	он	H CH₂OH
Me	iPr	Н	OMe	H CH₂NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF <sub>3</sub>	H CH₂Ph
Me	tBu	iPr	OnPr	Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Et	Me	Ph	OiPr	Me COMe
iPr	Et	н	Ph	Me COOH
nPr	iPr	Me	SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu	nPr	€t	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	i₽r	NH <sub>2</sub>	Et CONHMs
OMe	Н	Н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	Н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	н	NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh	iPr	CH <sub>2</sub> OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH <sub>2</sub> NH2	Et	iPr SO₃H
SıPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	iPr	iPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub>	Н	CH₂Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	н	NHMs Cl
NHEt	Ph	COMe	Н	NHCOMe CI
NHPh	H	COOH	н	NO <sub>2</sub> CI
a	Me	CONH <sub>2</sub>	Н	CHO Br
CI	Et	CONHMe	Н	so₃H Br
CI	Ph	CONHMs	Me	SO₂NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	CI NHMs
Ph	CI	NO <sub>2</sub>	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO <sub>2</sub>
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO <sub>3</sub> H
a	Br	OH	Et	Br SO₂NHMe

【0290】 【表122】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>13</sup> R <sup>14</sup>
Me		Н	ОН	H CH₂OH
Me	iPr	н	OMe	H CH <sub>2</sub> NH2
Me	nPr	Me	OEt	H CH₂NHMe
Me	nBu	Et	OCF <sub>3</sub>	H CH₂Ph
Me	tBu	ì₽r	OnPr	Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph
Et	Me	Ph	OiPr	Me COMe
iPr	Et	н	₽h	ме соон
nPr	1Pr	Me	SEt	Me CONH <sub>2</sub>
nBu	nPr	Et	SiPr	Me CONHMe
tBu	nBu	iPr	NH <sub>2</sub>	Et CONHMs
OMe	Н	Н	NHMe	Et NHMs
OEt	Me	н	NHEt	Et NHCOMe
OiPr	Et	н	NHPh	Et NO <sub>2</sub>
OPh	iPr	CH <sub>2</sub> OH	Me	iPr CHO
SEt	Н	CH <sub>2</sub> NH2	Et	ìPr SO₃H
SiPr	Me	CH₂ÑHMe	ιPr	iPr SO₂NHMe
NH <sub>2</sub>	Н	CH₂Ph	Н	iPr OH
NHMe	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	н	NHMs CI
NHEt	Ph	COMe	H	NHCOMe CI
NHPh	Н	COOH	Н	NO₂ CI
a	Me	CONH <sub>2</sub>	Н	CHO Br
CI	Et	CONHMe	Н	SO₃H Br
a	Ph	CONHMs	Me	SO <sub>2</sub> NHMe Br
Me	CI	NHMs	Me	OH Br
Et	CI	NHCOMe	Me	Cl NHMs
Ph	CI	NO <sub>2</sub>	Me	CI NHCOMe
Br	Me	CHO	Et	CI NO <sub>2</sub>
Br	CI	SO₃H	Et	Br CHO
Me	Br	SO₂NHMe	Et	Br SO₃H
Cl	Br	OH	Et	Br SO <sub>2</sub> NHMe

【表123】

				-	
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Et	Н	CI	Н	OMe
н	iPr	Н	Br	Н	OCF3
Н	nPr	Н	NO <sub>2</sub>	н	OEt
Н	nBu	H	CHO	н	QiPr
Н	tBu	Н	so₃H	н	SMe
Me	Н	Me	CI	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
Me	ı₽r	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Εt	NHEt
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Et	$NMe_2$
iPr	н	iPr	CONHMe	i₽r	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	₽h	NO <sub>2</sub>	Ph	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	H	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe	CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe		CH <sub>2</sub> OMe	OH	CH <sub>2</sub> OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		CH2NH2	COMe	CH2NH2	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		$CH_2NH_2$	COOH	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OEt
CH <sub>2</sub> NHM	е Ме	CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH₂Ph	Et	CH <sub>2</sub> Ph	NHMs	CH₂Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> P	h iPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh

#### 【0292】 【表124】

R <sup>11</sup> R	13	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н Е		н	Cl	Н	OMe
	⊃r	н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
H n	Pr	Н	NO <sub>2</sub>	н	OEt
H ni	Bu	н	CHO	Н	OiPr
H tE	∃u	Н	so₃H	Н	SMe
Me l	Н	Me	Cl	Me	OMe
Me N	/le	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me E	≣t	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
Me il	Pr	Me	CH2NH2	Me	SMe
Me n	Pr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	OiPr
Me n	Bu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et '	Н	Et	COMe	Et	NHMe
Et N	лe	Et	COOH	Et	NHEt
Et !	Et	Et	CONH₂	Et	NMe <sub>2</sub>
iPr	Н	iPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr N	Иe	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	пBu	NHMs	nBu	OCF₃
tBu N	√le	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph !	Ph	Ph	NO <sub>2</sub>	₽h	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	H	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH N	Иe	CH <sub>2</sub> OH	so₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO <sub>2</sub> NHMe	CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe I	₽h	CH <sub>2</sub> OMe	OH	CH <sub>2</sub> OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COMe	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> I	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OEt
<u></u>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
<u>2</u>	Me	CH <sub>2</sub> Ph	CONHMs	CH <sub>2</sub> Ph	SMe
	Et	CH <sub>2</sub> Ph	NHMs	CH <sub>2</sub> Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	iPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh

[0293]

【表125】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	-	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Et	H	CI	-	Н	OMe
Н	iPr	Н	Br		Н	OCF <sub>3</sub>
Н	nPr	Н	NO <sub>2</sub>		Н	OEt
н	nBu	Н	CHO		Н	OiPr
н	tBu	н	SO₃H		Н	SMe
Me	н	Me	CI		Me	OMe
Me	Me	Me	Br		Me	OCF <sub>3</sub>
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH		Me	OEt
Me	ıPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe		Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph		Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe		Εt	NHMe
Et	Me	Et	COOH		Εt	NHEt
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>		Et	$NMe_2$
<b>i</b> Pr	Н	iPr	CONHMe		iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs		nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs		nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe		tBu	OEt
Ph	Ph	₽h	NO <sub>2</sub>		₽ħ	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	H	CH <sub>2</sub> OH	CHO		CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	so₃H		CH <sub>2</sub> OH	QPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe		CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe		CH <sub>2</sub> OMe	OH		CH <sub>2</sub> OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		$CH_2NH_2$	COMe		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	$OCF_3$
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Œt
CH <sub>2</sub> NHM		CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe		CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH <sub>2</sub> Ph	CONHMs		CH <sub>2</sub> Ph	SMe
CH <sub>2</sub> Ph	Et	CH₂Ph	NHMs		CH <sub>2</sub> Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> P	h iPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NO <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh
	<b>Y</b>	, <b>T</b>				

【0294】 【表126】

R <sup>11</sup> R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
H Et	Н	CI	Н	OMe
H iPr	Н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
H nPr	Н	NO <sub>2</sub>	н	OEt
H nBu	Н	CHO	Н	OiPr
H tBu	н	so₃H	н	SMe
Me H	Me	CI	Me	OMe
Me Me	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me Et	Me	CH₂OH	Me	OEt
Me iPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me nBu	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Me	OnPr
Et H	Et	COMe	Et	инме
Et Me	Et	COOH	Et	NHEt
Et Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Et	NMe <sub>2</sub>
iPr H	iPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph Ph	Ph	NO <sub>2</sub>	Ph	OiPr
CH₂OH H	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	
CH₂OH Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	
CH <sub>2</sub> OMe Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe	CH <sub>2</sub> OM	
CH₂OMe Ph	CH <sub>2</sub> OMe	ОН	CH <sub>2</sub> OM	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COMe	CH <sub>2</sub> NH	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH	CH <sub>2</sub> NH	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NH	
CH <sub>2</sub> NHMe Me	CH <sub>2</sub> NHMe		CH <sub>2</sub> NHM	
CH₂Ph Me	CH₂Ph	CONHMs	CH₂Ph	
CH₂Ph Et	CH <sub>2</sub> Ph	NHMs	CH₂Ph	
CH2CH2Ph iPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Ph SPh

[0295]

【表127】

		R"			
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н		Н	CI	Н	OMe
H	iPr	н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
H	nPr	н	NO <sub>2</sub>	н	OEt
H	nBu	Н	CHO	Н	OiPr
H	tBu	н	so₃H	н	SMe
Me	Н	Me	Cl	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
Me	iPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Me	OnPr
Et	Н	Et	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Et	NHE
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Et	$NMe_2$
iPr	Н	í₽r	CONHMe	ĭ₽r	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO <sub>2</sub>	₽h	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	Н	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH2OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SQ <sub>2</sub> NHMe	CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe	₽h	CH <sub>2</sub> OMe	OH	CH₂OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COMe	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	CH2NH2	COOH	CH2NH2	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	$CH_2NH_2$	OEt
CH <sub>2</sub> NHMe		CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH <sub>2</sub> Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH₃Ph	Et	CH <sub>2</sub> Ph	NHMs	CH <sub>2</sub> Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	ı iPr	CH2CH2Ph	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh
	0 2 0	6			

【0296】 【表128】

RB N OH Me

		R			
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	 R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Et	 Н	Cl	Н	OMe
H	iPr	Н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
н	nPr	Н	$NO_2$	Н	OEt
H	nBu	н	CHO	Н	OiPr
H	tBu	Н	SO₃H	Н	SMe
Me	Н	Me	Cl	Ме	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
Me	iPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Εt	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Εt	COOH	Ét	NHEt
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Et	$NMe_2$
ıPr	Н	íPr	CONHMe	iPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	Ph	NO <sub>2</sub>	Ph	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	Н	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe	CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe	Ph	CH <sub>2</sub> OMe	ОН	CH₂OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	$CH_2NH_2$	COMe	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OEt
CH <sub>2</sub> NHMe	) Me	CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
CH₂Ph	Me	CH <sub>2</sub> Ph	CONHMs	CH <sub>2</sub> Ph	SMe
CH₂Ph	Et	$CH_2Ph$	NHMs	CH <sub>2</sub> Ph	OPh
CH₂CH₂PI	h iPr	 CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh

[0297]

【表129】

		ĸ			
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Et	Н	CI	Н	OMe
н	iPr	Н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
H	nPr	Н	NO <sub>2</sub>	н	OEt
H	nBu	Н	CHO	Н	OiPr
H	tBu	Н	SO₃H	Н	SMe
Me	Н	Me	Cl	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF3
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
Me	iPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	OiPr
Me	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Εt	COMe	Εt	NHMe
Et	Мө	Et	COOH	Εt	NHEt
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Εt	NMe <sub>2</sub>
iPr	Н	iPr	CONHMe	íPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	₽h	NO <sub>2</sub>	Ph	OiPr
CH₂OH	Н	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe	CH <sub>2</sub> OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe	Ph	CH <sub>2</sub> OMe	ОН	CH <sub>2</sub> OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COMe	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH	$CH_2NH_2$	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	$CH_2NH_2$	CONH <sub>2</sub>	$CH_2NH_2$	OEt
CH <sub>2</sub> NHMe		CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OïPr
CH₂Ph	Me	CH₂Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH <sub>2</sub> Ph	Et	CH₂Ph	NHMs	CH <sub>2</sub> Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	ıiPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	$NO_2$	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh
	0 2 0	0			

#### 【0298】 【表130】

R <sup>11</sup> F	₹13	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>
Н	Et	Н	Cl	Н	OMe
	iPr	Н	Br	Н	OCF <sub>3</sub>
	nP <b>r</b>	н	NO <sub>2</sub>	Н	OEt
	nBu	Н	CHO	Н	OiPr
	tBu	Н	SO₃H	Н	SMe
Me	Н	Me	Cl	Me	OMe
Me	Me	Me	Br	Me	OCF <sub>3</sub>
Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> OH	Me	OEt
	ιPr	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	SMe
Me	nPr	Me	CH₂NHMe	Me	OiPr
Me i	nBu	Me	CH₂Ph	Me	OnPr
Et	Н	Εt	COMe	Et	NHMe
Et	Me	Et	COOH	Εt	NHEt
Et	Et	Et	CONH <sub>2</sub>	Et	NMe <sub>2</sub>
iPr	Н	iPr	CONHMe	ιPr	NMeEt
nPr	Me	nPr	CONHMs	nPr	OMe
nBu	Et	nBu	NHMs	nBu	OCF <sub>3</sub>
tBu	Me	tBu	NHCOMe	tBu	OEt
Ph	Ph	₽ħ	NO <sub>2</sub>	Ph	OiPr
CH <sub>2</sub> OH	Н	CH <sub>2</sub> OH	CHO	CH <sub>2</sub> OH	SMe
CH <sub>2</sub> OH	Me	CH <sub>2</sub> OH	SO₃H	CH <sub>2</sub> OH	OPh
CH₂OMe	Et	CH <sub>2</sub> OMe	SO₂NHMe	CH₂OMe	SPh
CH <sub>2</sub> OMe	Ph	CH <sub>2</sub> OMe	OH	CH <sub>2</sub> OMe	NHPh
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	$CH_2NH_2$	COMe	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OMe
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	COOH	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	$CH_2NH_2$	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OEt
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	CONHMe	CH <sub>2</sub> NHMe	OiPr
CĤ₂Ph	Ме	CH₂Ph	CONHMs	CH₂Ph	SMe
CH₂Ph	Et	CH <sub>2</sub> Ph	NHMs	CH₂Ph	OPh
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	iPr	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	NO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	SPh

[0299]

【表131】

HN-R			
HN ~~	ни он	HN	HN N
HN	HN	HN	HN N N
HN	F	ни	°
HN	HN~~CI	HN	-F HN
HN	HN	F	HN S
HN	HN	HN	HN ~ ~ 0 ~
HN	HN	HN COOH	HN~°
HN	HNOH	F NH2	HN
HN	HN O		HN
HN	HN	HN Me	HN N CI
HN	HN S	HN	HN N
ни О О	HN	HN OH	Ü

【0300】 【表132】

HN <del>-</del> R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN	HN HN
HN	$\bigcirc$	óн
ни✓	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN ~~~	ни	HN HN
HN	HN \	F
HN ~	····	HN HN N
HN	ни	HN\\S\\\\HN\\\
HN ~~	HN	HN O
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN N HN S
HN OH	ни	HN CO HN CO

[0301]

# 【表133】

HN-R			
HN F	HN NH2	HN	Ae CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN	HN CO <sub>2</sub> H	NHCH₂PI	Me N. Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> M	HN NH.	HN OMe
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC HN	Me O <sub>2</sub> SHN	HN H <sub>2</sub> N
HN OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub> E	t Ph
HN	HN	ONH <sub>2</sub> CN	HN O
HN OH	Me O HN	HN	HN
HNOH	OCF <sub>3</sub>	HN	HN SH

#### 【0302】 【表134】

HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OC O	OMe
CH <sub>2</sub> OH	NHCOOEt HN	HNOMe
сосн₃	HN OPh	HN
HN CI	HN OCOCH3	HN CO <sub>2</sub> H
HN CI	Me OH	HN COMe
HN~~	OH Me	HN Br
HN	OH Br	HN N H
HN	HN~~	Н

	Me	
HN-R		
Me HN	HN	HN
HN H	HN	HN
HN	HNN	HN NH2
ни	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN	HN Ne-S-NH	HNOMe
HN N	HN OH	HN
HN N	HN H	HN N
HN N	HN N	HN O
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN O	HN N	HN CI

# 【0304】 【表136】

		ME		
_	HN-R			
	HN S	HN N	HN	HN N
	HN N-N	HN	HN	HN N
	HN	HN	HN O	HN N
	HN N	HN N	HN	HN-R
	HN N >-cı	HN CI	HN N NH	HN
	N N		-IN-	HN_N
	HN N	HN N	TN	ни
	HN N	ни	) HN~~~	
	HN \\	HN TH	) HN N-S	HN N
	HN S	HN S	→ HN \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\	I HN N

[0305]

HN-R		
HN – Me	ни	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN ~	$\sim$	óн 🧼
HN ~	HN	HN HN
ни	HN	HN HN CF
ни	HN	HN O HN
HN	$\bigcap$	I F
HN	HN	HN Me
ни	HN	HN~S
HN ~	HN	HN~0.
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN NH HN S
HN OH	HN	HN O HN TO

# 【0306】 【表138】

[0307]

【表139】

	Me	
HN-R		
HN	HNODEI	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	HN HN	OMe
CH₂OH HN	NHCO OEI	HNOMe
COCH₃	HN	HN
ÇI	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN CI	HN OH	HN COMe
HN CO	HN Me	HN Br
HN	HN OH Br	HN

# 【0308】 【表140】

HN-R		
HN	ни	HN
HN_N	HN	HN
HN	HN N	HN NH2
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HNON	OH OH	HNOOH
HN	HN H	HN^N
HN N	HN N	HN O
HN HN	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN O	HN~~N	HN CI

特願2004-084605

【表141】

HN-R	
HN N HN N HN N	
HN HN HN N	
HN N HN HN HN N	
HN N HN	
HN N CI HN N HI HN	
HN N HN N HN N	
HN N HN TO HN TN HN TN	_
HN HN HN N-S	O
HN THE HN THE HN THE	)

【0310】 【表142】

HN-R		
HN-Me	HN A	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN	$\bigcirc$	ÓН
ни∕√	HN	HN HN F
HN	HN	HN HN CF
ни	ни	HN HN
HN ~	HN	· ~
HN	niv -	HN N
HN	HN	HN~S
ни	HN	HN~0~
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH		HN \O HN \\O
HN \	HN	

[0311]

HN-R			
HN \ F	HN NH2	ни	HN CI
HN T	HCOHN	MeHN HN	HN
HN	HN CO <sub>2</sub> H	NHCH₂PI	Me N Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> Me	HN NHA	AC ON
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC HN →	Me O <sub>2</sub> SHN	HN H <sub>2</sub> N
HO OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO₂EI	HN Ph
HN O	HN	NH <sub>2</sub> CN	HN O Me
ни	Me O	HN	ни
HN OH	OCF <sub>3</sub>	HN CI	HN

#### 【0312】 【表144】

	MIE	
HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	MeOCO HN	OMe
CH₂OH	NHCOOEI HN	HN OMe
COCH³	HN OPh	HN OMe
, CI	HN OCOCH3	HN CO <sub>2</sub> H
HN CI	HN OH	HN COMe
HN CO	OH Me	HN Br
HN CO	OH Br	HN H

HN−R		
Me HN	HN	HN
HN-N	HN	HN
HN	ни	HN NH₂
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH NH O2	HN
HN N	HN OH	HN
HN N	HN H	HN
HN N	HN N	HN
HN	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN O	HN	HIN CI

【0314】 【表146】

HN-R			
HN S	HN	HN~N	HN N N
HN N-N	HN	HN	HN
HN N	HN N	ни	HN
HN N	HN N	HN S	HN (
HN N -CI	HN CI	HN	HN
N-1	ö LY+	en company	HN N
HN N	HN	,_N	HN N
HN N	ни	HN	\_\n\_\_\ \?
HN \\\	HN NH	HN N-S	HN N
HN S	HN S	- HN	HN N
[0:	3 1 5 ]	<del></del>	

【表147】

	1710	
HN-R	<u> </u>	
HN-Me	HN-A	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN~	$\Diamond$	бн 🤍
ни 🗸	ни	HN HN
ни	ни	HN HN CF
HN ~~~	HN	HN HN
HN ~		····   +
HN	HN	HN N N N
ни	HN	HN~S
HN	HN	HN ~ 0 .
HN	HN	HN O HN
ни		HN N HN S
HN ~	ни	
HN OH	HN	HN HN HN

#### 【0316】 【表148】

HN-R			
HN F	HN NH <sub>2</sub>	HN	HN C
HN F	HCOHN	MeHN HN	CI CI
HN	CO <sub>2</sub> H	HN NHCH2	HN Me N Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> M	HN	HN O
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC HN	Me O <sub>2</sub> SHN	H <sub>2</sub> N
HO OH	HN NO2	NHSO₂t HN	HN Ph
HN	HN	HN C	HN~
ни	Me O	HN	HN
HNOH	OCF <sub>0</sub>	HN	HN SH

[0317]

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	MeOCO HN	OMe
CH <sub>2</sub> OH	NHCOOE	HN OMe
COCH <sub>3</sub>	HN	HN
ÇI	HN OCOCH₃	HN NO <sub>2</sub>
HN	HN	HN COMe
HN CCO	HN Me	HN Br
HN O	OH Br	HN H

# 【0318】 【表150】

HN-R		
Me HN	HN	HN
HN-N	HN	HN
HN	HN N	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH <sub>2</sub>	HNNHMe
HN OH	HN Me-s-NH	HNOMe
HN ~Ņ ◯	O <sub>2</sub> OH	HN
HN~N	OMe HN H	HN
HN N	HN N	HN~°C
HN N	HN~~	HN
HN~~o	HN	HN CI
HN		CI

	Me	Me.	
HN-R			
HN~\\S	HN N	HN N	HN N N
HN N-N	HN N	HN~\\	HN
HN N	HN N	ни	HN
HN N	HN~N	HN S	HN-R
HN N CI	HN CI	HN N NH	HN
HN N		-IN	HN~N
HN N	~~°	) HN	HN
r's	ни	N-S	HN
HN	HN H	⊢ HN \ H \	HN TH
HN	HN	<u> </u>	- U

【0320】 【表152】

HN-R		
HN-Me	HN A	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
HN		он 🛴
ни∕√	ни	HN HN
HN \	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN
HN 1	HN \	····   F
ни	$\bigcirc$	HN HN N
HN	HN	HN S HN
ни	HN	HN~~°
HN	HN	HN O HN
ни	HN	HN N HN NS
HN OH	HN	HN O HN O

[0321]

	Me	Me	
HN-R			
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHN	HN CI
HN F	HOOHN	HN	HN CI
HN	HN CO <sub>2</sub> H	NHCH₂PI	Me N-Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> Me	HN	Ac OMe
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN	H <sub>2</sub> N
HO OH	HN NO2	NHSO₂Et	HN Ph
HN	HN	NH <sub>2</sub> CN	HN C Me
HNOH	Me O HN	HN	HN
HN OH OH	OCF <sub>3</sub>	HN	HN

# 【0322】 【表154】

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	HN HN	OMe
CH₂OH HN	NHCOOEI	HN OMe
сосн₃	HN	HN OMe
CI	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN CI	HN OH	HN COMe
HN~~~	OH Me	HN NHC OPI
HN O	OH Br	
HN	HN	НИ

	1016	
HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH₂
HN	HN NH2	HN NHMe
HN OH	HN Me-S-NH	HNOME
HN N	OH OH	HNOOH
HN N	HN H	HN~N
HN N	HN N	HN
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN O	HN	HN CI

# 【0324】 【表156】

HN-R			
HN S	HN	HN N	HN N
HN N-N	HN N	HN	HN
HN N	HN	ни	HN
HN N	HZ N N	ни 🤝	HN
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
'n-J	-	HN	HN N
HN N	HN	N	HN
HN N	HN O	) HN N-S	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN CO	HN N	HN N-S	HN N
HN S	HN	> HN TH	

[0325]

HN-R			
HN	HN~	HN ~~	HN N
HN	óн " 🎧	HN \	
HN	HN	HN ~	HN
HN	HN		F HN N
D	HN	HN	HN N J
HN	HN	HN F	HN ~~~S~
HN	F		HN ~ C
HN \	HN ~ ·	ни соон	HN
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
	HN	HN ~	HN
HN	····	HN Me	HN N -CI
ни	HN	HN	N
HN OH	HN		HN
HN O	HN \	HNOH	

【0326】 【表158】

HN-R			
HN ^	HN ~	HN	HN N
HN	óн	ни	HN N N
HN	HN	HN \\	1
HN	HN CI	HN	-F HN ✓ N ✓
HN \	HN	√_ <sub>F</sub>	HN N
$\bigcap$	HN	HN F	HN~S
HN~~	F	HN \	HN
HN	HN	г соон F	N.
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
	HN	HN	N N
HN OH	HN	HN	HN~~~
HN	HN	он	

【表159】

HN-R			
HN ~	ни ОН	HN~	ни
HN	HN	HN O	HN N
HN	F	HN	0 
HN	HN	HN	F HN
HN \	HN		HN S
HN	HN F.	HN	HN~~°
HN	HN	HNCOOH	HN O
HN	HN	.F	HN
$\bigcap$	ÓH HN T	hN NH2	HN
HN	8	ни ме	HN N CI
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	<i>B</i>
<u> </u>		OH	

【0328】 【表160】

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN N
HN	ни	HN	HN N N
HN	F	HN~~	
HN	HN C1	HN	F HN
HN	HN	√ F	HN S
HN ~	HN	HN	HN~~0~
HN \	HN	HN COOH	HN O
HN	HN	HN \	HN
$\bigcap$	OH HN	NH₂ HN	HN
HN	8	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	144 //
0	ни	фн	

【表161】

【0330】 【表162】

HN OH HN N	)
HN HN	
HN S	)
HN HN F HN	P P
HN N HN N S	,
HN HN F	·
HN HN HN O	
	N T
HN OH HN NH2	Ä ≫
HN HN HN HN Me	> <sup>™</sup> =\
HN HN N	.}—cı
HN HN N	J
HN HN OH	-

【表 1 6 3】

	1916		
HN-R			
HN	ни	HN \	HN
HN	HN	HN	
HN~	HN	HN \	F HN
	HN	HN F	HN N
HN	ſ NH	HN HN	HN~~S.
HN	HN F.	F HN →	HN ~ 0 ~
HN	HN	F COOH	HN
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN T	HN HN Me	HN N=
HN	HN S	HN	HN N D-CI
ни	HN		HN N
HN	HN	HN OH	

【0332】 【表164】

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN
HN	ни	HN	
HN	F	HN \	8
HN	HN CI		F HN N
. D	HN	HN	HN N J
HN	NI NI	HN	HN
HN	HN F	<sup>‡</sup>	HN~~O~
HN	HN	HN COOH	HN O
HN	HN	HN HN	ни
$\bigcap$		NH₂ HN	HN
HN \		ни ме	HN N CI
HN	HN \	HN	N-1
HN OH	HN		HN N
HN	HN	HNOH	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN	HN N
HN	HN O	HN	HN N N
HN	ſ~\ <sup>F</sup>	ни	
НИ	HN	HN	-F HN
HN	HN	2 F	HN S
HN O	HN	HN	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN	HN N
HN	HN S	HN Me	HN N CI
HN OH	HN		HN N
HN ON	HN \	ни	

【0334】 【表166】

HN-R			
HN	ни	ни	HN N
HN	HN \	ни	HN N N
HN	F	HN	, N
HN	HN	HN	-F HN
HN	HN	1 <sub>2</sub>	HN S
HN	HN	HN	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN~°°
HN	HNOH	.F HN NH <sub>2</sub>	HN
HN			HN N
HN		HN-Me	HN N CI
ни	HN	HN	HN N
ни фн	HN	ни	· ·

HN-R			
HN~	HN OH	HN~~	ни
HN	HN	HN	HN N
HN	F	HN	
HN	HN	ни	F HN
HN~	HN	F	HN S
HN	HN	HN F	HN ~ ~ 0 ~
HN \	HN F	HN COOH	HN
HN	HN	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN CO	HN	HN	HN
HN	LINI CO	HN	HN N CI
HN \	HN	HN	HN N
ни фн	ни	HNOH	Ü

【0336】 【表168】

HN-R			
HN ~	ни	HN	HN
HN	HN	HN C	HN N N
HN~	HN F	HN	F HN N
···· \	HN	HN	HN N
HN~	ſ NH	H <sub>2</sub>	HN~~S~
HN \	HN F	į.	HN O
HN~	HN ~	HN COOH	HN O
HN	HN	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN		HN N CI
HN T.	HN	HN	Ly WHH
ни Он	ни	ни	_

# 【0338】 【表170】

HN-R			
HN	HN OH	HN ~	HN
HN	HN	HN O	HN N N
HN	F F	HN \	, C
HN	HN		F HN N
$\sim$	HN	HN C	HN ~ N
HN	NH <sub>2</sub>		HN~~S~
HN	HN	HN	HN~~O~
HN \	HN	HN COOH	HN O
HN	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN		HN
HN	HN	HN	

【0340】 【表172】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	HN
HN		HN C	HN N N
HN	HN	HN \\	
HN	HN	HN	F HN
HN	HN NH	,	HN N
HN CO	HN	* HN	HN O
HN \	HN F	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN~~~	HN S	HN	LN N
ни Он	ни	HNOH	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	HN N
НИ	HN	HN^	HN N N
HN	F	HN \\	, v
HN	HN		F HN N
$\overline{\wedge}$	HN	HN F	HN N
HN	ſ~ NH:		HN~~S.
HN~	HN	HN	HN~~O~
HN \	HN	HN COOH	HN O
HN	HNOH	HN NH2	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN	HN	HN	HN N CI
ни	HN		HN~N
HN 0	HN	HNOH	

【0342】 【表174】

HN -R			
HN	ни	н	HN
HN	HN	HN	HN
HN	F	ни	
HN	HN	HN	F HN
HN	HN NH	, F	HN S
HN CO	HN	HN F	HN O
HN	HN	ни соон	HN O
HN	) HN	F HN	HN
	OH HN	HN NH2	HN
HN		HN Me	HN N CI
ни	HN	HN	N-J
HNOH	HN	HN	HN
HN	ни	он он	

HN-R			
HN /	HN OH	ни	ни
HN		HN	HN N C
HN	HN F	HN ~	/s
HN	HN CI		F HN N
	ни	HN F	HN ~ N ~
HN	HN	HN I	HN S
HN	 F		HN
HN (	HN	HN COOH	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
	HN		HN N
HN	····	HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N-J
ни	HN		HN NH
HN O	HN \	HNOH	

#### 【0344】 【表176】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	HN
HN	_	HN C	HN N
HN ~	HN	ни	E HN N
HN	اعرا	HN^()_	HN
HN	HN NH <sub>2</sub>		HN~~S~
HN	HN F	HN	HN~~O~
HN	HN J	HN COOH	HN O
HN \	HN	HN	HN
HN	HN	HN NH2	HN
HN		HN Me	HN N CI
1	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	ď
<u></u>		On .	

HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN
HN		HN	
HN	HN F		HN \\
HN ~	ни	HN	F HN N
	HN	HN	HN N
HN	NH	2	HN~~S~
HN	HN F. ®	HN	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN N
HN	HN	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN	HN N
HN OH	HN		ни ~ й »
HN	ни	ни он	

【0346】 【表178】

HN-R			
ни	HN OH	HN \	HN
HN		HN	
HN	HN	HN~~	,
HN	HN	HN \	F HN O
HN	HN	√√ <sub>F</sub>	HN N
HN	HN	HN F	HN O
HN \	HN F	HN COOH	HN
$\bigcap$	HN		HN N
HN	·''' 6 <sub>H</sub>	HN NH <sub>2</sub>	N N
HN	HN	HN HN Me	HN N CI
HN	HN J	HN	HN
ни	HN		HN~N
HN	HN \	HNOH	

	<del></del>		
HN-R			
HN	HN OH	HN~~	HN N
HN	HN O	HN	HN N T
HN \	HN	HN \	F HN
HN \	HN	HN F	HN ~ N
HN CO	HN NH2	HN F	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN
HN \	HN OH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN		HN
HN	HN	HN Me	HN N CI
HN OH	HN		HN N
HN OH	HN \	ни	

【0348】 【表180】

HN-R			
HN ~	HN ~	HN \	HN N
HN	όн		
HN \	HN	HN	HN N
	ſ~\ <sup>F</sup>	HN~~	
HN	HN		F HN N
~		HN	HN N
HN ~	HN	· ·	6
$\sim$	HN	HN I	HN
HN~	F. A	F	HN^\O\
. 0	HN	HN COOH	HN
HN	^_	F 😞	N.
HN	HN	HN	HN
niv	όн	ŃH₂	, N
HN~	HN	HN	HN
1		HN Me	HN N CI
HN	HN S	HN	N
HN ~~	. HN \		HN~N
ÓН	. '		Ö
HN	HN	HN OH	

【表181】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	н	iPr	CHŌ	Н	ιPr	Н	CHO	iPr
н	Н	nPr	so₃H	н	nPr	н	SO₃H	nPr
н	Н	nBu	a	Н	nBu	н	CI	nBu
н	Н	tBu	Br	H	tBu	н	Br	tBu
H	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	Н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH;	
iPr	Н	н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH;	
н	Εt	Н	CONHMe	Εt	Н	Εt	CONHM	
Н	iPr	н	CONHMs	íPr	н	1Pr	CONHM	
н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	н	nBu	NHCOM	
н	tBu	H	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	$NO_2$	Н
Н	Ph	Н	CHO	Ph	н	Ph	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	Н	Εt	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	пPr	Н	nPr	Н	OH
Cl	Ph	Н	OH	₽h	Н	₽ħ	Н	COMe
Et	Cl	Н	COMe	CI	Н	CI	Cl	COOH
nPr	a	Н	COOH	Ci	Н	CI	CI	CONH <sub>2</sub>
₽h	Cl	н	CONH <sub>2</sub>	Cl	Н	CI	Cl	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Εt	Н	CONHMS
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	Cl	n₽r	н	NHMs
Н	₽h	CI	NHMs	₽h	a	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	$NO_2$	Me	Н	Me	Н	ОН
Et	Et	Н	OH	Et	Н	Εt	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	H	Ph	н	NO <sub>2</sub>

# 【0350】 【表182】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	i₽r
Н	н	nPr	SO₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	CI	н	n₿u	Н	Cl	nBu
н	н	t⊟u	Br	н	tBu	Н	Br	tBu
н	Н	₽h	CH <sub>2</sub> OH	н	₽ħ	н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH	
iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	Н	н	Н	CH <sub>2</sub> Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	H	Н	Н	CONH;	
н	Et	н	CONHMe	Et	н	Et	CONHM	
Н	iPr	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	
H	n₽r	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	$NO_2$	H
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO <sub>3</sub> H	Εt	Н	Εt	Н	SO <sub>2</sub> NHM
CI	nPr	н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	н	nPr	H	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	CI	н	COMe	Cl	H	CI	Cl	COOH
nPr	CI	H	COOH	CI	н	CI	CI	CONH <sub>2</sub>
Ph	a	н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	CI	Cl	CONHM
H	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHM
H	nPr	CI	CONHMs	nPr	Cl	nPr	Н	NHMs
H	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	₽ħ	н	$NO_2$
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	OH	Et	Н	Et	н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	н	nPr	Н	COOH
₽'n	Ph	н	COOH	Ph	н	Ph	н	NO <sub>2</sub>

【表183】

R <sup>13</sup>	14							
R.	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	Н	ıPr	CHŌ	Н	ıPr	н	CHO	iPr
Н	Н	nPr	so₃H	н	nPr	Н	so₃H	nPr
н	н	nBu	ci	Н	nBu	Н	Cl	nBu
Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
H	H	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ρh	Н	CH <sub>2</sub> OH	₽h
Et	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
iPr	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	Н	Н	н	CH₂Pħ	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	Н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	Н
₽h	н	Н	CONH <sub>2</sub>	H	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
Н	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
Н	i₽r	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	n₽r	NHMs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	$NO_2$	Н
н	Ph	н	CHO	Ph	Н	Ph	н	SO₃H
CI	Εt	Н	SO₃H	Εt	Н	Et	н	SO <sub>2</sub> NHMe
Cl	nPr	н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	Ci	Н	COMe	Cl	н	CI	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	CI	a	CONH <sub>2</sub>
Ph	CI	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	CI	CI	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Εt	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	н	NHMs
Н	Ph	Cl	NHMs	₽h	а	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	$NO_2$	Me	Н	Me	Н	OH
Εt	Et	Н	он	Et	Н	Εt	H	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	H	NO <sub>2</sub>

【0352】 【表184】

#### 【衣104】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	Н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ìPr
Н	Н	nPr	SO₃H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	Cl	Н	nBu	Н	CI	nBu
Н	Н	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Н	₽h	Н	CH <sub>2</sub> OH	
Εt	H	н	CH2NH2	Н	H	Н	CH <sub>2</sub> NH	
iPr	Н	Н	CH₂NHMe	Н	Н	н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	н	Н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	
tBu	н	Н	COOH	Н	н	Н	COOH	
Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH;	
н	Et	Н	CONHMe	Et	Н	Εt	CONHM	
н	īPr	н	CONHMs	ıΡr	Н	iPr	CONHIV	
Н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	н	t₿u	NO <sub>2</sub>	н
Н	Ph	н	CHO	₽h	Н	₽h	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO₃H	Εt	н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHM
Cl	nPr	Н	SO₂NHMe	n₽r	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	₽h	н	Ph	Н	COMe
Et	CI	н	COMe	Cl	Н	Cl	CI	COOH
nPr	Cl	н	COOH	a	Н	a	a	CONH <sub>2</sub>
Ph	CI	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	Cl	CI	CONHM
н	Et	CI	CONHMe	Εt	Cl	Et	Н	CONHM
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
Н	₽ħ	a	NHMs	₽h	CI	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	он
Et	Et	Н	ОН	Et	Н	Et	H	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	н	COOH	₽h	Н	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

[0353]

【表185】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et.	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	Н	iPr	CHŌ	н	iPr	Н	CHO	iPr
Н	Н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	SO₃H	nPr
Н	Н	nBu	a	Н	nBu	Н	CI	nBu
Н	Н	tBu	Br	н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	Ph	Н	CH <sub>2</sub> OF	
Et	Н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	H	н	CH <sub>2</sub> NH	
ıPr	Н	H	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHN	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	Н	Н	н	CH <sub>2</sub> Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	Н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	н	CONH	
Н	Et	Н	CONHMe	Et	Н	Et	CONHM	
H	iPr	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	is H
н	nPr	Н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	Н
Н	nBu	н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
н	tBu	н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	$NO_2$	H
Н	Ph	Н	CHŌ	Ph	н	Ph	Н	SO <sub>3</sub> H
CI	Et	Н	SO₃H	Et	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHM
Cl	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	n₽r	Н	ОН
Cl	Ph	Н	он	₽h	Н	₽ħ	Н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	Н	a	Cl	COOH
nPr	CI	Н	COOH	Cl	Н	Cl	a	CONH <sub>2</sub>
Ph	C!	н	CONH <sub>2</sub>	Cl	Н	CI	CI	CONHM
Н	Et	a	CONHMe	Et	Çl	Εt	Н	CONHM
н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	H	NO <sub>2</sub>
Me	Me	н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	он	Εt	H	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	Н	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

#### 【0354】 【表186】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
Н	Н	íPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	i₽r
Н	н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	SO <sub>3</sub> H	nPr
H	Н	nBน	CI	н	nBu	Н	CI	nBu
Н	H	tBu	Br	Н	tBu	Н	Br	tBu
Н	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	₽h	Н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	Н	н	$CH_2NH_2$	н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH:	
iPr	н	Н	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHN	
nPr	Н	Н	CH₂Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	н	H	COMe	Н	н	Н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
H	Et	Н	CONHMe	Εt	Н	Εt	CONHM	
н	iPr	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHM	
Н	nPr	н	NHMs	n₽r	Н	nPr	NHMs	Н
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	t₿u	$NO_2$	Н
Н	₽h	Н	CHO	₽h	Н	Ph	Н	SO₃H
CI	Et	Н	SO <sub>3</sub> H	Εt	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	Н	SO₂NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	ОН	Ph	H	Ph	Н	COMe
Et	Cl	Н	COMe	Cl	н	CI	CI	COOH
nPr	CI	Н	COOH	CI	Н	CI	CI	CONH <sub>2</sub>
Ph	Cl	Н	CONH <sub>2</sub>	Cl	Н	Cl	CI	CONHMe
Н	Et	CI	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
н	Ph	CI	NHMs	Ph	CI	Ph	Н	$NO_2$
Me	Me	н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Et	Et	Н	он	Et	Н	Et	н	COMe
nPr	nPr	н	COMe	nPr	Н	nPr	H	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph	H	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

【表187】

				IVIE				
R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R13	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	H	iPr	CHÔ	н	iPr	Н	CHO	iPr
H	Н	nPr	SO <sub>3</sub> H	Н	nPr	Н	SO₃H	nPr
н	H	nBu	αĭ	Н	nBu	н	Cl	nBu
H	Н	tBu	Br	Н	tBu	н	Br	tBu
Н	н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	н	Ph	н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	
iPr	н	н	CH₂NHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	н	Н	CH₂Ph	Н	Н	Н	CH₂Ph	Н
nBu	Н	Н	COMe	Н	н	Н	COMe	н
tBu	н	Н	COOH	Н	Н	Н	COOH	
Ph	Н	H	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH;	
Н	Εt	Н	CONHMe	Εt	Н	Et	CONHM	
н	iPr	н	CONHMs	i₽r	н	iPr	CONHIV	
Н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	. н
Н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCON	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	NO <sub>2</sub>	Н
Н	₽ħ	Н	CHO	Ph	Н	Ph	Н	SO₃H
Cl	Et	Н	so₃H	Et	Н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
C1	nPr	Н	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	Н	nPr	Н	OH
Cl	Ph	Н	ОН	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Εt	Cl	Н	COMe	a	Н	Cl	CI	COOH
nPr	CI	Н	COOH	Cl	Н	CI	Cl	CONH <sub>2</sub>
Ph	Cl	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	CI	CI	CONHMe
Н	Εt	Cl	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHMs
Н	n₽r	CI	CONHMs	nPr	ÇI	nPr	Н	NHMs
Н	Ph	CI	NHMs	₽h	CI	Ph	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Εt	Et	Н	он	Et	Н	Et	Н	COMe
n₽r	nPr	Н	COMe	n₽r	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	Ph_	<u>н</u>	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

## 【0356】 【表188】

R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
Н	Н	Et	NO <sub>2</sub>	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Et
H	н	iPr	CHO	Н	iPr	Н	CHO	ıPr
Н	н	nPr	SO₃H	н	nPr	Н	so₃H	nPr
Н	Н	nBu	a	Н	nBu	Н	a	nBu
н	Н	tBu	Br	н	tBu	Н	Br	tBu
H	Н	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Н	₽h	Н	CH <sub>2</sub> OH	
Et	н	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NH:	
iPr	Н	Н	CH₂ÑHMe	Н	Н	Н	CH <sub>2</sub> NHM	
nPr	Н	н	CH <sub>2</sub> Ph	н	Н	Н	CH₂Ph	
nBu	Н	Н	COMe	Н	Н	Н	COMe	Н
tBu	н	н	COOH	Н	н	Н	COOH	
Ph	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	Н	Н	Н	CONH <sub>2</sub>	
Н	Et	Н	CONHMe	Et	Н	Et	CONHIV	
Н	í₽r	Н	CONHMs	iPr	Н	iPr	CONHIV	
Н	nPr	н	NHMs	nPr	Н	nPr	NHMs	
н	nBu	Н	NHCOMe	nBu	Н	nBu	NHCOM	
Н	tBu	Н	NO <sub>2</sub>	tBu	Н	tBu	NO <sub>2</sub>	H
Н	Ph	Н	CHO	Ph	Н	₽h	Н	SO <sub>3</sub> H
C1	Εt	н	SO₃H	Εt	н	Et	Н	SO <sub>2</sub> NHMe
CI	nPr	Н	SO₂NHMe	nPr	н	nPr	Н	OH
CI	Ph	Н	OH	Ph	Н	Ph	Н	COMe
Et	CI	Н	COMe	CI	Н	a	a	COOH
nPr	CI	Н	COOH	a	Н	Cl	CI	CONH <sub>2</sub>
Ph	CI	Н	CONH <sub>2</sub>	CI	Н	CI	a	CONHMe
Н	Εt	Cl	CONHMe	Et	CI	Et	Н	CONHMs
Н	nPr	CI	CONHMs	nPr	CI	nPr	Н	NHMs
Н	Ph	Cl	NHMs	₽h	CI	₽h	Н	NO <sub>2</sub>
Me	Me	Н	NO <sub>2</sub>	Me	Н	Me	Н	OH
Εt	Et	н	OH	Et	Н	Et	Н	COMe
nPr	nPr	Н	COMe	nPr	Н	nPr	Н	COOH
Ph	Ph	Н	COOH	₽h	Н	Ph	Н	NO <sub>2</sub>

【表189】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	н	Н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	Н	CHO	Н	Н	Н	CHO
H	н	nPr	Н	SO₃H	н	н	Н	so₃H
H	н	nBu	н	ci	н	н	Н	CI
Н	н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Εt	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ιPr	Et	ìPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	H	Ph	tBu	CHO	₽h	tBu	Ph	Н
Pb	Cl	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	C1	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Ci	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εŧ	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph		Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	n COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
	T 0	2 5	. 2					

【0358】 【表190】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н —	NO <sub>2</sub>	н		Н	н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
н	н	nPr	Н	so₃H	Н		Н	Н	so₃H
H	Н	nBu	H	CĪ	н		H	Н	CI
H	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	H		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н		Me	Н	CH₂Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н		Ме	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		Et	н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Εt	iPr	CONHMS
ıPr	Н	nPr	i₽r	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	₽h	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	a	Et	Ph	SO₃H	Εt		Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	n₽r	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe			CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h		CH <sub>2</sub> OH	₽h	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nРг	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs			CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽h		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH₂NHMe	Ме	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH₂Ph	OH	Et		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph_	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н_

[0359]

【表191】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	н	NO <sub>2</sub>
н	н	ìPr	Н	сно	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	н	Н	H	SO₃H
H	Н	nBu	н	ci	Н	Н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	H	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	H	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	ιPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et	Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	C1	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	C1	CH2NH2	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	инмs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pl	COOH	Ph ——	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

#### 【0360】 【表192】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
н	Н	Et .	н	NO <sub>2</sub>	Н		н —	Н	NO <sub>2</sub>
н	Н	ıPr	н	CHO	Н		Н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	Н		Н	Н	so₃H
H	Н	nBu	Н	CĪ	H		Н	Н	Cl
н	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Ме	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	н		Me	н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	₽ħ	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	îPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	n₽r		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	H
сн₂он	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH2NH2	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		$CH_2NH_2$	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt		CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	n₽r	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	1 COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph_	н
	( C	3 6	1 ]						

【表193】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R1	1	R <sup>13</sup>	R14
Н	Н	Et	Н —	NO <sub>2</sub>	н	1		н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	н	CHO	Н	F		Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	н	F		Н	so₃H
H	Н	nBu	Н	ci	Н	ŀ		Н	CI
Н	H	tBu	Н	Br	н	H		Н	Br
Ме	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	М		Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	М		Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	H	M		Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н		e	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	n⊟u	н	Me	COMe	Н		le	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		le	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		t	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt		∃t	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr		≣ŧ	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		⊃r	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	n₽r	NHCOMe	nBu		Pr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		3u	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ρh		3u	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt		h	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		<sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h		<sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	CI		OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI		OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		$_{2}NH_{2}$	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		$_{2}NH_{2}$	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		$_{2}NH_{2}$	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		$_2NH_2$	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me		NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Εt		l <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	n₽r	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	n₽r		l <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph		Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pł	COOH	Ph	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
	_ <b>/</b> ^	2 6	2						

# 【0362】 【表194】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н	Н	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	iPr	н	CHO	н	н	Н	CHO
Н	Н	nPr	н	SO₃H	н	н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	H	ci	н	н	Н	CI
н	Н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	€t	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHM
Et	Н	iPr	Εt	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHM
iPr	Н	nPr	íPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	H	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOM
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	a	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	a	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	C1	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	$CH_2NH_2$	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	Н
CH <sub>2</sub> NHM e	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pr	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	Н
		Ph		COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	

[0363]

【表195】

				1110					
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	•	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
н	н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н		Н	Н	NO <sub>2</sub>
н	Н	ıPr	Н	CHO	Н		Н	Н	CHO
н	Н	nPr	н	SO₃H	H		Н	Н	so₃H
н	Н	nBu	н	ci	Н		Н	Н	CI
Н	Н	tBu	н	Br	Н		Н	Н	Br
Me	Н	H	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	ıPr	Εt	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
ĭ₽r	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ρh		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Et	Н
CH₂OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH₂OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	C1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH2NH2	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et		CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	_	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	1 COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	₽h	н
						,			

### 【0364】 【表196】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н —	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н		н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	Н	CHO	Н		Н	Н	CHO
н	Н	nPr	Н	so₃H	н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	Н	ď	н		Н	Н	Cl
н	Н	tBu	Н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	Н	Me	CH <sub>2</sub> OH	н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	íPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н		Me	H	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	н		Ме	Н	CH <sub>2</sub> Ph
	nBu	н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Et	Et	CONHMe	Εt		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	ìPr		Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	n₽r	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	Cl	Et	₽h	SO₃H	Et		Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		$CH_2NH_2$	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		$CH_2NH_2$	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Ме	н
CH₂Ph	Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nΡr		CH₂Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	COOH	Ph	C.	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

[0365]

【表197】

HN-R		
HN-Me	ни	HN HN
HN-Et	HN	HN HN
HN	$\frown$	óн
HN ~	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN	HN	HN HN
HN		· ·
HN	HN	HN N N N
HN	ни	HN~s
ни	HN	ни~
HN~~	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN CO HN CO
HIN I		

### 【0366】 【表198】

	INE		
HN-R			
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NH	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN	HN
HN F	HN CO <sub>2</sub> H	HN NHCH²!	Ph Me N Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> h	hn Ni	HN OME
HN NH <sub>2</sub>	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN	HN
HO OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	Et Ph
HN	HN	HN C	N HN O Me
HN OH	HN	HN	HN
HNOH	OCF <sub>3</sub>	HN	HN

	MB	
HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HNODE	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	OMe
CH₂OH HN	NHCOOE	HNOMe
COCH <sub>3</sub>	HN OPh	HN
Ç1	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN CI	HN OH	HN COMe
HN CO	OH Me	HN Br
HN O	HN Br	HN H

#### 【0368】 【表200】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH2	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HN	OH OH	HNOOH
HN N	OMe HN H	HNON
HN PI	HN N	HN O
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN O	HN N	HN CI

【表201】

HN-R			
HN~ LS	и п	HN N	HN N
N-N	HN	HN~N	HN N
HN N	HN N	HN~~~	HN N
HN N	HN ~ N	ни	ни 🗸
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
N		4N C	HN~N
HN	HN	FN)	HN
HN	HN N	HN N-S	HN
HN	HN NH		0
HN	HN S	→ HN TN	) HN JN C

【0370】 【表202】

HN-R			
HN	HN OH	HN \	ни
HN	HN F	HN C	HN
HN	HN CI	HN C	F HN N
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN CF	HN S
HN	HN F	HN F	HN O
HN	HN ~	HN COOH	HN O
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN N
ни	HN	HN HN Me	HN N=
HN	HN	HN	HN N CI
HN OH	HN		HN~N
HN	ни	HNOH	

[0371]

HN-R			
ни	HN OH	HN~~	ни
HN	HN-	HN	HN
HN \	HN F	HN	= HN
		HN C	HN NO
HN	HN	2 HN	HN S
HN \	HN F	ł	HN O
HN	HN	HN COOH	HN
HN	HN OH	HN NH2	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN S	HN	N NH
HN OH	HN	HN OH	Ü

#### 【0372】 【表204】

HN-R		
HN-Me	ни 🛆	HN HN
HN –Et	HN .	HN HN
HN	$\Diamond$	ÓН
ни∕√	HN	HN HN
HN	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN
HN ~	HN \	F
ни		HN HN N
HN~	HN	HN~S
HN	HN	HN~~0
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN O	HN CO HN CO
HN J		

	Н	Mie	
HN-R			
HN F	HN NH2	HN NHI	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN	HN CO <sub>2</sub> H	NHCH₂PI	HN Me N. Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> Me	HN NH.	AC OM
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN HN	HN H <sub>2</sub> N
HO OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO₂E	t Ph
HN	HN NHCO	HN CN	HN
HN OH	MeO HN	HN	HN
HN OH	OCF3	HN	HN

#### 【0374】 【表206】

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	OMe
CH₂OH	NHCOOEt	HN OMe
COCH3	HN	HN
CI	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN	HN OH	HN COMe
HN CO	HN Me	HN Br
HN	HN Br	HN

HN-R		
HN HN	HN	HN
HN .N	HN	HN
HN	HN~~N	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH <sub>2</sub>	HNNHMe
HN OH	HN NH O2	HN OMe
HN~N	OH OH	HN
HN N	HN H	HNON
HN N	HN N	HN~°C
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN 0 0	HN	HN CI

【0376】 【表208】

	H	ме	
HN-R			
HN \ S	ни	HN N	HN
HN N-N	HN	HN	HN N
N= N=	HN N	HN	HN N
HN N	HN N	HN	HŅ-Q
HN N CI	HN N CI	HN N NH	HN
Cu Cu	N F	in of	HN N
HN	HN N	I N	HN
HN N S	HN N	HN N-S	HN N N
HN	HN H	u	О
HN	HN S	- HN TH	HN TÜ
[0:	3 7 7 <b>]</b>		

HN−R		
HN-Me	HN-A	HN HN
HN –Et	HN	HN HN
HN	$\Diamond$	он 💮
HN ∕	HN	HN HN
HN ~	HN	HN HN F
HN	HN	HN HN
HN ~		F
ни	HN	HN N MB
HN	HN	HN~S
ни	HN \	HN~~0~
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN O	HN O HN CO
HN		

#### 【0378】 【表210】

HN -R			
HN F	HN NH <sub>2</sub>	HN	Me HN CI
HN F	HCOHN	MeHN	HN CI
HN	CO <sub>2</sub> H	NHCH <sub>2</sub> F	HN Me N. Me
HN F	HN CO <sub>2</sub> N	le HN NH	HN OMe
HN NH <sub>2</sub>	H <sub>2</sub> NOC HN →	Me O <sub>2</sub> SHN	HN H <sub>2</sub> N
HN OH	HN NO <sub>2</sub>	HN NHSO <sub>2</sub> i	Et Ph
HN	HN	ONH <sub>2</sub> CI	HN C Me
HN OH	MeO HN	HN	HN
HNOH	HN OCF3	HN CI	HN

【表211】

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	OMe
CH <sub>2</sub> OH	NHCOOE:	HN OMe
сосн₃	HN	HN
HN CI	HN OCOCH3	HN CO <sub>2</sub> H
HN CI	Me OH	HN COMe
HN ~ C	OH Me	HN Br
HN \\	OH Br	
HN	HN	HN

### 【0380】 【表212】

HN-R		
HN	HN	HN
HN_N	HN	HN
HN	ни	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
ни ф	O <sub>2</sub> OH	ни
HN N	HN H	HN~N
HN P	HN~N	HN
HN N	HN	HN
HN O	HN	HN CI
HN O		

【表213】

HN-R			
HN ~ LS	N N	HN N	HIN N
HN N-N	HN	HN N	HN N
HN N	HN N	HN ~ °	HN N
HN N	HN N	HN~	HŅ 🔏
HN N CI	HN N CI	HN NH	HN
N	HN N F	IN OF THE PROPERTY OF THE PROP	HN
N NH	0	] HN	HN
HN N	HN ~~~	N-8'	HN
HN	HN N	→ HN → H	н
HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	HN S		8 💚

#### 【0382】 【表214】

HN-R		
HN-Me	ни	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
ни	$\triangle$	ÓН
ни✓	HN	HN HN
ни	HN	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN		F ~
HN	HN	HN Ne HN N
HN \	ни	HN S HN
HN	HN	HN~^^
HN	HN	HN O HN
ни	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN O HN O
, in [		

[0383]

	Me	Me	
HN-R			
HN F	HN NH2	ни	HN CI
HN F	HOOHN	MeHN HN	HN
HN	CO <sub>2</sub> H	NHCH₂P!	Me N Me
HN	HN CO <sub>2</sub> M	e HN NH/	HN OMe
HN NH2	H <sub>2</sub> NOC	Me O₂SHN HN	HN H <sub>2</sub> N
HN OH	HN NO2	NHSO <sub>2</sub> EI	HN Ph
HN	HN NHCC	DNH <sub>2</sub> CN	HN
HN OH	Me O	HN	ни
HN OH	OCF <sub>3</sub>	HN	HN

#### 【0384】 【表216】

	1016	
HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	OMe OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	OMe
CH₂OH HN	NHCOOE	HN OMe
COCH3	HN	HN OMe
CI	HN OCOCH3	HN CO <sub>2</sub> H
HN CI	HN OH	HN COMe
HN CCO	OH Me	HN Br
HN CO	HN OH Br	HN
	_	

【表217】

	Me Me	
HN-R		
HN Me	HN	HN
HN H	HN	HN
HN	HN N	HN NH₂
ни	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HNOMe
HN N	OH OH	HNOOH
HN N	HN H	HN N
HN	HN ~ N	HN
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN~~o	ни	HN
HN \O\		CI
<b>T</b> 0 0	o c 1	

【0386】 【表218】

	ME		
HN-R			
HN~ S	HN N	HN	HN N
HN N-N	HN	HN	HN N
HN N	HN	HN	HN N
HN N	HN N	ни	ни
HN N -CI	HN N CI	HN NH	HN
M	[ Z	4N~ O~	HN
HN N	HN	) UN N	HN
HN N A	HN	HN N-S	HN
HN	HN	ш	н
HN S	HN	≻ HN \\	HN TN TO

[0387]

【表219】

HN-R		
HN-Me	HN A	HN HN
HN-Et	HN 💭	HN HN
HN	$\wedge$	óн
HN ~	HN	HN HN
HN	HN	HN HN F
HN ~~	HN	HN HN
HN ~	HN	l F
ни	FIN -	HN Me
HN	ни	HN~S~
HN	HN	HN ~ 0 .
ни	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN (O HN (TO)
AIN II .		

#### 【0388】 【表220】

【表221】

HN-R		
HN SO₃H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	Me OCO	OMe
CH₂OH	NHCOOE	HN OMe
COCH³	HN	HN
ÇI	HN OCOCH3	HN CO <sub>2</sub> H
HN CI	HN OH	HN COMe
hn CCO	OH Me	HN NHC OPr
HN	OH Br	HN H

#### 【0390】 【表222】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN N	HN NH <sub>2</sub>
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN Me-S-NH	HNOMe
HN N N	O <sub>2</sub>	HN
HN	HN H	HN
HN N	HN N	HN~O
HN N	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN~~o	ни	HN CI
		CI
7 0 0	^ 1 T	

[0391]

【表223】

HN-R			
HN	N N	HN	HN N N
HN N-N	HN	HN~N	HN N
HN N	HN N	HN~	HN
HN	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	HN	HN-Q
HN N CI	HN OCI	HN NH	HN
N-)		HN OS	HN~\n'\
HN	HN N	) HN	HN N
HN N	HN	HN N-8	
HN	HN H	u	Ö H
HN S	HN S	≻ HN TN C	) HN TN ()

【0392】 【表224】

HN-R		
HN-Me	HN A	HN HN
HN-Et	HN .	HN HN
ни~	$\cap$	он О
ни∕▽	HN	HN HN F
ни	HN	HN HN F
HN	ни	HN HN
HN ~	HN CO	F Me (
HN		HN HN N
HN~	HN	HN S HN
ни	HN \	HN O
HN	HN	HN O HN
HN	HN	HN HN S
HN OH	HN	HN O HN O

[0393]

		ivie	
HN-R			
HN	HN NH2	ни	HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN \\	HN CO <sub>2</sub> H	NHCH₂PI	HN Me
HN	HN CO₂M	e HN NH/	Ac OMe
HN NH <sub>2</sub>	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN	H <sub>2</sub> N
HO OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO₂E	HN
HN	HN	DNH <sub>2</sub> CN	HN 2 Me
ни	Me O	HN	HN
HNOH	OCF <sub>3</sub>	HN	HN

#### 【0394】 【表226】

	Me	
HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S	MeOCO HN	OMe
CH₂OH	NHCOOEt	HN OMe
COCH₃	HN	HNOMe
C1	HN OCOCH3	HN NO <sub>2</sub>
HN CI	Me OH	HN COMe
HN S_O	OH Me	HN NHC OPI
HN O	OH Br	HN H

【表227】

HN-R		
HN Me	HN	HN
HN N	HN	HN
HN	HN ~~~ NH	HN NH₂
HN	HN NH <sub>2</sub>	HN NHMe
HN OH	HN NH O2	HN OMe
ни~и	O <sub>2</sub> OH	HN
HN N	HN H	HN
HN N	HN HN	HN
HN P	HN	HN NH <sub>2</sub>
HN~~o\$	HN	HN
HN O		CI

【0396】 【表228】

HN-R			
HN	HN	HN~N	HN N N
HN N-N	HN	HN~N	HN N
HN N	HN N	HN	HN
HN N=	HN N	HN	ни-{
HN N= CI	HN N CI	HN NH	HN
HN N	HN	HN J	HN N
HN	HN O.	) HN	HN
HN \\	HN N	N-S N-S	HN
HN S	HN	HN TH	HN TH
[ 0	3 9 7]		

【表229】

HN-R		
HN-Me	HN	HN HN
HN-Et	HN	HN HN
HN	$\sim$	OH V
ни∼∨	ни	HN HN
HN	ни	HN HN F
HN	HN	HN HN
HN ~		· ·
HN	HN~~~	HN N N N
HN	ни	HN~S
HN	HN	HN~~0
HN ~	HN	HN HN
ни	HN	HN NH HN S
HN OH	ни	HN CO HN CO
LIIM I		

### 【0398】 【表230】

HN-R			
HN F	HN NH2	HN NH	Me HN CI
HN F	HCOHN	MeHN HN	HN
HN F	CO <sub>2</sub> H	NHCH <sub>2</sub> F	h Me N Me
HN F	HN CO₂N	HN NH	IAc OM
HN NH <sub>2</sub>	H <sub>2</sub> NOC	Me O <sub>2</sub> SHN HN	HN H <sub>2</sub> N
HN OH	HN NO <sub>2</sub>	NHSO₂t HN	HN Ph
HN	HN	ONH <sub>2</sub> CI	HN O Me
ни он	HN HN	HN	ни
HN OH	HN OCF3	HN	HN

[0399]

【表231】

HN-R		
HN SO <sub>3</sub> H	HN OEt	HN Me
H <sub>2</sub> NO <sub>2</sub> S HN	Me OCO	OMe
CH <sub>2</sub> OH	NHCOOE	HN OMe
COCH3	HN	HN
CI	HN OCOCH <sup>S</sup>	HN NO <sub>2</sub>
HN	HN Me OH	HN COMe
HN CH	OH Me	HN Br
HN O	HN OH Br	HN H

#### 【0400】 【表232】

HN-R  Me HN	
HN H	
HN H	
HN OME S-NH OME	
HN OH MO-S-NH OME	NH₂
HN OH HN OME ONE	
	C
HN N HN HN HN T	OH
HN N HN N HN N	J
HN N HN O	0
HN HN HN	C NH2
HN~~O	CI
HN	CI

【表233】

HN-R			
HN S	ни	HN N	HN N
HN N-N	HN	HN~N	HN N
N N	HN N	HN	ни
HN N	HN N	HN	~
N=\	HN N CI	HN NH	HN
HN		·~	HN N
Ly NH	HN N	-IN	
HN		) HN	ни Пи
F3	HN N	HN N-S	HN
HN	HN H	ы	H
HN	HN S	→ HN JN C	) HN TN O

#### 【0402】 【表234】

HN-R			
HN	LIM I	HN \	HN N
ни	11 -1	HN \	HN N N N
HN \	HN F	HN~~	1
HN	HN	HN \	= HN ✓ N
HN \	HN	Ų√ <sub>F</sub>	HN N
	HN NH	HN F	HN O
HN	F C	HN COOH	HN O
HN			
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN N
HN	HN	HN \	HN
HN ~	HN S		HN~N
ни Он	HN	HN OH	

[0403]

HN-R			
HN ~	ни	HN~~	HN
HN	όH	ни	HN
ни	HN F	HN~~	···
HN	HN CI	HN ~	F HN NO
HN ~	ни	Ų√ <sub>F</sub>	HN
	HN	t <sub>2</sub>	HN S
HN	F	HN	HN
HN \	HN	F coon	HN
HN	ни	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN		HN
1		HN Me	HN N -CI
HN	HN	HN	N N
HNOH	HN		HN~~~
HN ~	HN \	HN OH	

#### 【0404】 【表236】

HN-R			
HN	riik j	ни	HN N
HN~~~	óн Он	HN \	HN ON NO
HN	HN	ни	···
HN	HN CI	HN \	F HN ✓ V
HN \	ни	√√ <sub>F</sub>	HN ~ N
····	HN	HN F	HN ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~
HN	F	HN	HN O
HN	HN	соон F	N
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN \	8
	FIIN	фн	

[0405]

HN-R			
ни	HN OH	ни	HN
HN	HN O	HN	HN N N
HN	HN	HN	- HN N
HN	C	HN C	HN NO
HN ~	HN NH	3 <sub>2</sub>	HN~~S~
HN \	HN F	į (	HN O
HN \	HN \	HN COOH	HN N
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN		HN
HN		HN Me	HN N CI
HN ~	HN	HN	HN N
ни Он	HN \	HN OH	-

#### 【0406】 【表238】

HN-R			
HN ~	HN OH	HN \	HN
HN		HN C	HN N N
HN	HN	HN ~	, (C)
HN	HN	HN \	F HN \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
HN ~	HN	Ų√ <sub>F</sub>	HN N
$\cap$	HN	2 HN	HN O
HN	HN F	HN \	HN
HN	(*************************************	соон	~N 7
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN	HN	HN HN Me	HN
HN			HN N CI
	HN	HN	HN N
HN OH	HN	HN	ð
	···· N	Он	

HN-R			
HN ~	HN OH	HN~~	HN N
HN~~~		ни	HN N N
HN	HN F	HN \	1
HN	HN CI	11 .	F HN N
HN	HN	V ← F	HN N
( )	HN	HN F	HN S
HN ~	F	HN \	ни
HN \	HN	''' <sup>'</sup> соон F ~	HN
HN	HNOH	HN NH <sub>2</sub>	HN
HN ~	HN	HN	HN
1		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N
HNOH	HN		HN
HN	ни	НИОН	

#### 【0408】 【表240】

HN-R			
HN	HN OH	HN	HN
HN	HN	HN	HN
ни	HN	HN \	F HN N
	HN	HN F	HN N
HN AN	HN	HN F	HN S
HN \	HN F	HN COOH	HN~O
HN	HNOH	HN \	HN
HN \	HN	HN LIN	HN
HN		HN .Me	HN N CI
HN OH	HN S		HN N
HN OIT	HN (	HN	

[0409]

【0410】 【表242】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н		н	н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	Н	CHŌ	н		Н	Н	CHO
н	н	n₽r	Н	SO <sub>3</sub> H	н		Н	Н	so₃H
H	Н	nBu	H	ci	н		Н	Н	CI
Н	н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н		Me	н	CH2NH2
Me	iPr	H	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	н		Me	Н	COOH
€t	₽h	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et		Εt	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	īPr		Et	îPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	хМНИ
nPr	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Et		Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe			CH <sub>2</sub> OH	nPr	H
CH <sub>2</sub> OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH₂OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs			CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pr	Ph	₽h	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	1 COOH	₽h	С	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н
		$\frac{1}{1}$	1			-			

[0411]

【表243】

				.,				
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	₽14
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	н	CHŌ	Н	н	н	CHO
H	н	nPr	Н	SO <sub>3</sub> H	н	H	н	so₃H
н	н	nBu	H	CI	Н	н	н	CI
H	н	tBu	н	Br	Н	н	н	Br
Me	Н	₽h	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	H	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	cH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Мe	COOH	Н	Me	н	COOH
Et	Ph	Н	Εt	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHŌ	₽h	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Εt	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI	CH₂OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ρh	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph —	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

#### 【0412】 【表244】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н Н	н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н	н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	Н	CHO	Н	н	Н	CHO
H	H	nPr	н	so₃H	Н	Н	Н	so₃H
н	Н	nBu	н	ci	Н	н	Н	Cl
н	н	tBu	н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	$CH_2NH_2$
Me	íPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н	Me	Н	CH₂Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	H	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	CI	Εt	Ph	so₃H	Εt	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Cl
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	C1	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Et	CH₂Ph	онī	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	₽h	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
				_				

[0413]

【表245】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н		н	Н	NO <sub>2</sub>
Н	Н	iPr	н	CHO	Н		Н	н	CHO
H	Н	nPr	н	SO <sub>3</sub> H	Н		Н	Н	SO₃H
н	Н	nBu	н	ci	н		Н	Н	Cl
н	Н	tBu	н	Br	н		Н	Н	Br
Мe	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Ме	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	iPr	CONHMs
iPr	Н	n₽r	iPr	NHMs	n₽r		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	₽h	Н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt		₽h	Εt	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	H
CH <sub>2</sub> OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h		CH <sub>2</sub> OH	₽h	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OM e	COOH	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	C1	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	Н
CH₂ÑHM e	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	(	H <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH₂Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Н
CH₂Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	Н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pl	COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	H

【0414】 【表246】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14		R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	н		Н	н	NO <sub>2</sub>
Н	H	iPr	н	CHO	H		Н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	SO <sub>3</sub> H	Н		H	н	SO₃H
н	Н	nBu	н	ci	Н		Н	Н	CI
Н	н	tBu	Н	Br	н		H	Н	Br
Me	н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εŧ	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н		Ме	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н		Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н		Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	Н		Me	Н	COOH
Et	₽h	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н		Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	н	Et	Et	CONHMe	Et		Et	Εt	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr		Et	íPr	CONHMs
iPr	Н	nPr	iPr	NHMs	nPr		iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu		nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu		nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ph		tBu	Ph	н
₽h	CI	Εt	Ph	so₃H	Εt		Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph		CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	Cl		CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph		CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me		CH <sub>2</sub> NHMe		Me	C	H <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et		CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr		CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph	C	H <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	н
	( (	$\frac{1}{4}$ 1	5						
		,	~ <b>"</b>						

【表247】

H H H H Me Me Me T Me T T T T T T T T T T T T T	н н н	Et iPr	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
H H H Me Me Me Me T Me T T T T T T T T T T T	H H		н					
H H H Me Me Me Me T Me T T T T T T T T T T T	H H			NO <sub>2</sub>	н	Н	H	NO <sub>2</sub>
H H Me Me Me Me I Me I Me I T Me I T Me I T Me I T T T T T T T T T T T T T T T T T T	Н		H	сно	H	H	н	CHO
H H Me Me Me Me I Me I Me I I I I I I I I I		nPr	Н	5O₃H	Н	н	Н	so₃H
H Me Me Me I Me I Me I Et Et I I I I I I I I I I I I I I I I	н	nBu	н	cĭ	Н	Н	Н	CI
Me Me Me Me Me Me Et Et Et ET IPr nBu tBu	Н	tBu	H	Br	Н	Н	Н	Br
Me Me Me r Me t Et Et Et Fr nPr nBu tBu	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me i Me r Me t Et ! Et Et iPr nPr nBu tBu	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me r Me r Me t Et ! Et Et iPr nPr nBu tBu	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me r Me t Et Et Et iPr nPr nBu tBu	nPr	Н	Me	CH₂Ph	н	Me	н	CH <sub>2</sub> Ph
Me t Et Et Et iPr nPr nBu tBu	1Bu	Н	Me	COMe	н	Me	н	COMe
Et Et Et iPr nPr nBu tBu	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et Et iPr nPr nBu tBu	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et iPr nPr nBu tBu	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
íPr nPr nBu tBu	Н	ıPr	Et	CONHMs	iPr	Et	ìPr	CONHMs
nPr nBu tBu	Н	nPr	íPr	NHMs	nPr	íPr	nPr	NHMs
nBu tBu	н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
tBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	н
₽h	Cl	Et	Ph	so₃H	Εt	Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH2OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	C1	CI
CH₂OMe	nPr	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	Cl
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εŧ	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ρħ	Н
	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Pt	COOH	Ph ——	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

#### 【0416】 【表248】

R<sup>IS</sup> O OH Me

			R''					
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	Н	н	NO <sub>2</sub>
н	Н	iPr	н	CHO	н	H	Н	CHO
H	н	nPr	Н	SO₃H	н	н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	Н	ci	H	н	Н	Cl
H	Н	tBu	Н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	₽h	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	$CH_2NH_2$
Me	ìPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	n⊟u	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н	Me	н	COOH
Et	Ρh	Н	Εt	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Εt	CONHMe	Et	Et	Et	CONHMe
Et	Н	iPr	Εt	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
i₽r	Н	nPr	ıPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	Ph	Н
Ph	Cl	Et	₽h	so₃H	Εt	Ph	Et	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe		CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	n₽r	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH2NH2	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe		Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Et	H H
CH₂Ph	nPr	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph		n COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph_	

[0417]

【表249】

			R					
R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	Н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	Н	н	NO <sub>2</sub>
Н	н	iPr	н	CHO	Н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	н	so₃H	Н	Н	Н	so₃H
н	Н	nBu	Н	ci	Н	н	Н	CI
Н	Н	tBu	Н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Εt	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	iPr	H	Ме	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Et	Et	Εt	CONHMe
Εt	Н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHO	Ph	tBu	₽h	H
Ph	Cl	Et	₽h	so₃H	Et	Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nΡr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Cl	$CH_2NH_2$	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	n₽r	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	H
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	₽h	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Ме	Me	CH₂NHMe		Ме	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	H
CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Εt	CH₂Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	H
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph ————	Ph	Н

【0418】 【表250】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	Н	Н	н	NO <sub>2</sub>
Ĥ	Н	iPr	Н	CHO	н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	Н	so₃H	Н	н	Н	so₃H
H	Н	nBu	н	a	Н	н	Н	CI
н	Н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Ме	Н	₽h	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	i₽r	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	H	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	н	Me	Н	COMe
Me	tBu	Н	Me	COOH	н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Εt	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Εt	CONHMe
Et	Н	iPr	Εt	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
iPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	н	Ph	tBu	CHO	Ρħ	tBu	Ph	н
Ph	Cl	Et	Ph	SO₃H	Et	Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH <sub>2</sub> OH	CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	Cl	CH₂OMe	COOH	Cl	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH₂NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH₂Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Et	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	Н
CH₂CH₂Ph	Ph	Ph	CH₂CH₂Pt	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	н

【表251】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14	R <sup>11</sup>	R <sup>t3</sup>	R <sup>14</sup>
Н —	Н	Et	н	NO <sub>2</sub>	Н	н	Н	NO <sub>2</sub>
H	Н	iPr	H	CHO	н	н	Н	CHO
H	Н	nPr	Н	SO <sub>3</sub> H	Н	н	Н	SO₃H
н	н	nBu	н	cĭ	н	н	Н	Cl
H	Н	tBu	н	Br	н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me	ıPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	nPr	н	Me	CH₂Ph	н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	Н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	пВu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	Н	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	NO <sub>2</sub>
tBu	Н	Ph	tBu	CHŌ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	Ph	SO₃H	Εt	Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> OH	a	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> OH	CI	₽h	CH <sub>2</sub> OH	OH	Ph	CH <sub>2</sub> OH	Ph	Н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	Ci
CH₂OMe	nPr	Cl	CH₂OM e	COOH	CI	CH <sub>2</sub> OMe	Cl	C1
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Et	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	nPr	CH2NH2	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	n₽r	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	₽ħ	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	н
CH₂Ph	Et	Et	CH <sub>2</sub> Ph	OH	Et	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	n₽r	CH <sub>2</sub> Ph	COMe	nPr	CH₂Ph	nPr	
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH₂CH₂Pt	COOH	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н

【0420】 【表252】

R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R14
Н	н	Et	Н	NO <sub>2</sub>	H	н	Н	NO <sub>2</sub>
н	н	iPr	н	CHÕ	н	н	Н	CHO
н	н	nPr	н	SO <sub>3</sub> H	н	н	Н	SO₃H
H	Н	nBu	н	СĬ	Н	н	Н	Cl
H	Н	tBu	Н	Br	Н	н	Н	Br
Me	Н	Ph	Me	CH₂OH	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> OH
Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	H	Me	н	$CH_2NH_2$
Me	iPr	Н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> NHMe
Me	n₽r	H	Me	cH₂Ph	Н	Me	Н	CH <sub>2</sub> Ph
Me	nBu	н	Me	COMe	Н	Me	Н	COMe
Me	tBu	н	Me	COOH	Н	Me	Н	COOH
Et	Ph	н	Et	CONH <sub>2</sub>	н	Et	Н	CONH <sub>2</sub>
Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt	Et	Et	CONHMe
Et	н	iPr	Et	CONHMs	iPr	Et	iPr	CONHMs
ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr	iPr	nPr	NHMs
nPr	Н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu	nPr	nBu	NHCOMe
nBu	H	tBu	nBu	NO <sub>2</sub>	tBu	nBu	tBu	$NO_2$
tBu	Н	Ph	tBu	CHÖ	Ph	tBu	Ph	н
Ph	CI	Et	₽h	SO₃H	Εt	Ph	Et	н
CH₂OH	Cl	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr	CH <sub>2</sub> OH	nPr	н
CH₂OH	Cl	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH	₽h	CH <sub>2</sub> OH	₽ħ	н
CH <sub>2</sub> OMe	Et	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COMe	CI	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH <sub>2</sub> OMe	COOH	C1	CH <sub>2</sub> OMe	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	CI	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CI	CI
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	Et	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Εt	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	nPr	Н
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Ph	Н
CH <sub>2</sub> NHMe	Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHME	NO <sub>2</sub>	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Me	Н
CH <sub>2</sub> Ph	Et	Εt	CH₂Ph	OH	Εt	CH <sub>2</sub> Ph	Εt	Н
CH <sub>2</sub> Ph	nPr	nPr	CH₂Ph	COMe	nPr	CH <sub>2</sub> Ph	nPr	н
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Ph	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> PI	1 COOH	<b>P</b> h	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	Ph	Н
	T 0		Y					

[0421]

【表253】

Me         Et         Ph         Me         CH₂NH₂         H         Me         H         CH₂NH           Me         IPr         H         Me         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         CH₂NHME         H         Me         H         COMB         H         LE         LE         COMB         H         LE         LE         COMB         H         Me         H         COMB         H         Me         H         COMB         H         LE         LE         COMB         COMB         H         LE         LE         LE         LE         COMB         COMB         N         LE         LE         LE         LE         COMB         N									
H H IPP H CHO H H H CHO H H H IPP H SO <sub>3</sub> H H H H SO <sub>3</sub> H H H H IPP H SO <sub>3</sub> H H H H CHO H H H IPP H SO <sub>3</sub> H H H H CHO H H H IPP H SO <sub>4</sub> H H H H CH <sub>2</sub> OH H H H IBU H Br H H H CH <sub>2</sub> OH Me H Ph Me CH <sub>2</sub> OH H Me H CH <sub>2</sub> OH Me IPP H Me CH <sub>2</sub> OH H Me H CH <sub>2</sub> NH Me IPP H Me CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Me H CH <sub>2</sub> NH Me IPP H Me CH <sub>2</sub> NH Me IPP H Me COMe H Me H CH <sub>2</sub> NH Me IPP H Me COMe H Me H CH <sub>2</sub> NH Me IPP H Me COME H ME H CON EET Ph H ME COMH H ME H CON EET Ph H EET CONHMS IPP EET IPP CONHI IPP H IPP EET CONHMS IPP EET IPP CONH IPP H IPP IPP NHMS IPP EET IPP CONH IPP IPP NHMS IPP EET IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP NHMS IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP NHMS IPP IPP NHM IPP IPP IPP NHMS IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP IPP NHM IPP IPP NHM IPP IPP IPP IPP IPP IPP IPP IPP IPP IP	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>13</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>11</sup>	R13	R <sup>14</sup>
H H H IP' H CHO H H H SOJH H H H NP' H SOJH H H H SOJH H H NBU H CI H H H CHO H H H BU H CI H H H CHO Me H Ph Me CH2NH2 H Me H CH2NH Me IP' H Me CH2NH H Me H CH2NH Me NP' H Me CH2NH H Me H CH2NH Me NP' H Me CH2NH H Me H CH2NH Me NBU H ME COOH H ME H COOH ET Ph H ME COOH H ME H CONE ET Ph H ET CONH ET H IP' ET CONHMS IP' ET IT IP' CONH IP' H NBU ND2 180 ND2 IBU H NBU ND3 180 ND3 IBU H NBU ND3 180 ND3 IBU H BU NBU ND3 180 ND5 IBU H BU NBU ND3 180 NBU ND5 IBU H BU NBU ND3 180 ND6 CH2OH CI Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph H Ph CI ET Ph SOJH ET Ph ET H CH2OH CI CH2OH CONE CI CI CH3NH2 Ph CI CH2NH2 CONH IBU H BU CHO Ph BU NP' NH Ph CI ET Ph SOJH ET Ph ET H CH3NH CH3NH2 Ph CI CH3NH CH3NH ME ME CH3NH ME C	Н	Н		Н	NO <sub>2</sub>	н	Н	н	
H H H 18U H Br H H H Br Me H CH2NH Me H CH2NH Me Et Ph Me CH2NH Me H CH2NH Me H CH2NH Me Pr H Me H CH2NH Me Pr H Me Me Me ME CH2NHM Me ME ME CH2NHM Me ME ME CH2NHM ME ME ME COOH H ME H CH2NH ME	Н	Н	iPr	Н	CHO	H			
H H H 180 H CI H H H CI H H Br  Me H Ph Me CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Me H CH <sub>2</sub> NH  Me IPr H Me CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Me H CH <sub>2</sub> NH  Me IPr H Me CH <sub>2</sub> NHMe H Me H CH <sub>2</sub> NH  Me nPr H Me CH <sub>2</sub> NHMe H Me H CH <sub>2</sub> NH  Me nBu H Me COMe H Me H COME  Me nBu H Me COMH H Me H COME  Et Ph H Et CONH <sub>2</sub> H Et Et Et CONH  Et H IPr Et CONHME Et Et Et CONH  Et H IPr Et CONHMS IPr IPr NHM  IPr H nPr IPr NHMS nPr IPr nPr NHM  nBu H 180 nBu NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 H 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 NO <sub>2</sub> 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 180 NO <sub>2</sub> 180 NO <sub>2</sub> 180 nBu 180 NO <sub>2</sub> 1		н	nPr	н	SO <sub>3</sub> H	Н			
Me         H         Ph         Me         CH2OH         H         Me         H         CH2OH           Me         Et         Ph         Me         CH2OH         H         Me         H         CH2NH           Me         IPr         H         Me         CH2NHMe         H         Me         H         CH2NH           Me         nPr         H         Me         CH2NHMe         H         Me         H         CH2NH           Me         nBu         H         Me         COME         H         Me         H         COMH           Me         tBu         H         Me         COMH         H         Me         H         COMH           Me         tBu         H         Me         COMH         H         Me         H         COMH           Et         H         Et         Et         CONH         H         Et         Et         CONH           Et         H         IPr         Et         CONH         Bt         TPr         NH         CONH         NH         TPr         NH         Me         H         CONH         NH         TPr         IPr         CONH         NH		н	nBu	н		Н			
Me         Et         Ph         Me         CH₂NH₂         H         Me         H         CH₂NH           Me         IPr         H         Me         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         Me         H         CH₂NHMe         H         CH₂NHME         H         Me         H         COMB         H         LE         LE         COMB         H         LE         LE         COMB         H         Me         H         COMB         H         Me         H         COMB         H         LE         LE         COMB         COMB         H         LE         LE         LE         LE         COMB         COMB         N         LE         LE         LE         LE         COMB         N	н	н	tBu	Н	Br	Н			
Me         IPr         H         Me         CH2NHMe         H         Me         H         CH2NHMe           Me         nPr         H         Me         CH2Ph         H         Me         H         CH2Ph           Me         nBu         H         Me         COME         H         Me         H         CH2Ph           Me         tBu         H         Me         COME         H         Me         H         COME           Et         Fh         H         Et         CONHMe         Et         Et         H         CONHME         Et         Et         CH2OH         CH2OH         CH2OH         CH2OH	Me	н	Ph	Me	CH <sub>2</sub> OH	Н			CH <sub>2</sub> OH
Me         nPr         H         Me         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph         H         Me         H         CH₂Ph           Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COME         COME         H         Bu         COME         H         Et         H         COME         COME         H         F         III         COME         COME         H         DP         NHM         NP         NHM         NP         NHM         NP         NHM         NP         NHM         NP         NHM         NP         NHM         NH	Me	Et	Ph	Me	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Н			CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
Me         nBu         H         Me         COMe         H         Me         H         COMe           Me         tBu         H         Me         COOHe         H         Me         H         COMe           Et         Fh         H         Et         CONHa         H         Et         H         CONHa           Et         Fh         H         Et         Et         Et         Et         Et         CONHa           Et         H         iPr         Et         CONHa         iPr         iPr         ONHa           Et         H         iPr         Et         CONHa         iPr         iPr         ONHa           IPr         H         nPr         Et         CONHa         iPr         iPr         NHM           nPr         H         nPr         iPr         NHCO         nPr         NHM         NHO         NHM         NPr         NHM         NHO         NHM         NPr         NHM         NHO         NPr         NHM         NHO         NHA         NHO         NHA         NHO         NHM         NHO         NHA         NHO         NHA         NHO         NHA         NHO         NHA	Me	iPr	н	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	Н			CH <sub>2</sub> NHMe
Me         IBU         H         Me         COOH         H         Me         H         COOH           Et         Fh         H         Et         CONH0         H         Et         H         CONH0           Et         Fh         H         Et         Et         CONH0         Et         Et         Et         CONH0           Et         H         IPr         Et         CONH0         Et         Et         Et         CONH0           Et         H         IPr         Et         CONH0         IPr         IPr         CONH0         IPR         CONH0         IPR         CONH0         IPR         ONH0         ONH0         IPR         ONH0         ONH0	Me	nPr	Н	Me	CH₂Ph	Н			CH <sub>2</sub> Ph
Et   Fh	Me	กฮิน	Н	Me	COMe				
Et H Et Et CONHMe Et Et Et CONHMe  Et H IPr Et CONHMe IPr Et IPr CONHM  IPr H nPr IPr NHMS IPr IPr nPr NHM  IPR H nBu nPr NHCOMe nBu nPr nBu NHCOM  IBU H IBU nBu NO2 IBU nBu IBU NO2  IBU H Ph IBU CHO Ph IBU Ph H  Ph CI Et Ph SO3H Et Ph Et H  CH2OH CI nPr CH2OH SO2NHMe nPr CH2OH nPr H  CH2OH CI CH Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph H  CH2OME ET CI CH2OME COME CI CH2OME CI CI  CH3NH2 Ph CI CH3NH2 CONHME ET CH2NH2 CI CI  CH3NH2 H ET CH3NH2 CONHME ET CH2NH2 nPr H  CH3NH2 H Ph CH2NH2 NHMS Ph CH2NH2 nPr H  CH3NH4 H Ph CH2NH2 NHMS Ph CH2NH2 nPr H  CH3NH4 H Ph CH2NH4 NO2 ME CH3NHME ME H  CH3NHME ME ME CH2NHME NO2 ME CH3NHME ME H  CH3PH ET ET CH3PH COME NPr CH3PH ME H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH3PH ME H  CH3PH ET CH2NHME NO2 ME CH3PH ME H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH3PH ET H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH NP H  H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH COME NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM3PH NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM3PH NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM3PH NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CM3PH NP CM3PH NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM3PH NP CH4PH ME H  CH3PH RE ET CH3PH CM3PH NP CH4PH NP NP CH	Me	tBu	H	Me	COOH	н			
Et H iPr Et CONIMS iPr Et iPr CONHI iPr H nPr iPr NHMs nPr iPr nPr NHM nPr H nBu nPr NHCOMe nBu nPr nBu ND2 tBu H tBu nBu NO2 tBu nBu tBu NO2 tBu H Ph tBu CHO Ph tBu Ph H Ph Cl Et Ph SO <sub>3</sub> H Et Ph Et H CH <sub>2</sub> OH Cl nPr CH <sub>2</sub> OH OH Ph CH <sub>2</sub> OH nPr H CH <sub>2</sub> OH Cl Ph CH <sub>2</sub> OH OH Ph CH <sub>2</sub> OH Ph H CH <sub>2</sub> OMe Et Cl CH <sub>3</sub> OMe COME Cl CH CH <sub>3</sub> OMe Et Cl CH <sub>3</sub> OMe COME Cl CH <sub>2</sub> OMe Cl Cl CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> Ph Cl CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONHMe Et CH <sub>2</sub> OMe Cl Cl CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> Ph Cl CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONHMe Et CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Cl Cl CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> H Et CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> CONHMS nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Et H CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> H Ph CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> CONHMS nPr CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> H Ph CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H CH <sub>3</sub> NH <sub>3</sub> H Ph CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H CH <sub>3</sub> NH <sub>3</sub> H Ph CH <sub>3</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>3</sub> Ph H CH <sub>3</sub> NH <sub>3</sub> Ph Et CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>3</sub> NH <sub>4</sub> Ph H	Et	Ρh	Н	Et	CONH <sub>2</sub>	Н			
Pr	Et	Н	Et	Et	CONHMe	Εt			CONHMe
NHCOM	Εt	н	iPr	Et	CONHMs	iPr			CONHMs
NO2	ıPr	н	nPr	iPr	NHMs	nPr			
H		н	nBu	nPr	NHCOMe	nBu			NHCOMe
Ph	nBu	Н	tBu	nBu	$NO_2$	tBu			
CH2OH	tBu	н	Ph	tBu	CHO				
CH2OH CI Ph CH2OH OH Ph CH2OH Ph H CH2OMe Et CI CH2OMe COMe CI CH2OMe CI CI CH3OMe nPr CI CH3OMe COOH CI CH2OMe CI CI CH3NH2 Ph CI CH2NH2 CONH2 CI CH2NH2 CI CI CH3NH2 H Et CH2NH2 CONHME Et CH2NH2 Et H CH3NH2 H nPr CH2NH2 CONHME nPr CH2NH2 nPr H CH3NH2 H Ph CH3NH2 NHMS NPr CH2NH2 nPr H CH3NH2 H Ph CH3NH2 NHMS Ph CH2NH2 Ph H CH3NHME ME CH2NHME NO2 ME CH2NHME ME H CH3Ph Et Et CH2Ph CH Et CH3Ph nPr H CH3Ph nPr nPr CH2Ph COMe nPr CH3Ph nPr H	Ph	CI	Et	Ph	so₃H	Εt			
CH₂OH         CI         Ph         CH₂OH         OH         Ph         CH₂OH         Ph         H           CH₂OMe         CI         CH₂OMe         COMe         CI         CH₂OMe         CI         CI         CH₂OMe         CH₂OMe         CH₂OMe         CH₂OMe         CH₂OMe <td>CH<sub>2</sub>OH</td> <td>CI</td> <td>nPr</td> <td>CH<sub>2</sub>OH</td> <td>SO<sub>2</sub>NHMe</td> <td>nPr</td> <td></td> <td></td> <td></td>	CH <sub>2</sub> OH	CI	nPr	CH <sub>2</sub> OH	SO <sub>2</sub> NHMe	nPr			
CH2OMe         Et         CI         CH2OMe         COMe         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CI         CI         CH2OMe         CH2OME         CH2OME         CH2OME         CH2OM		CI	Ph	CH <sub>2</sub> OH	OH				
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Ph   Cl   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   CONH <sub>2</sub>   Cl   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Cl   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Ph   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   CONHMe   Et   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Et   H   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   H   nPr   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   CONHMS   nPr   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Ph   H   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   H   Ph   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   NHMS   Ph   CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>   Ph   H   CH <sub>2</sub> NHMe   Me   Me   CH <sub>2</sub> NHMe   NO <sub>2</sub>   Me   CH <sub>2</sub> NHMe   Me   H   CH <sub>2</sub> Ph   CH   Et   CH <sub>2</sub> Ph   Et   H   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   COMe   nPr   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   H   CH <sub>2</sub> Ph   nPr   N		Εt	CI		COMe				
CH2NH2         Ph         CI         CH3NH2         CONH2         CI         CH2NH2         CH2NH2         CH2NH3         CH2NH3         CH2NH3         CH2NH3         CH3NH3         Ph         CH2NH3         Ph         CH3NH4         Ph         H           CH2NHM2         Me         Me         CH2NH4         NMs         Ph         CH2NH4         Ph         H           CH3NHM6         Me         Me         CH3NH4         NMs         Ph         CH3NH4         Ph         H           CH3NHM6         Me         CH3NH4         NMs         NMs         CH3NH4         Ph         H           CH3NHM6         Me         CH3NH4         NMs         NMs         CH3NH4         Ph         H           CH3NHM6         Me         CH3NH4         NMs         NMs         Ph         CH3NH4         Ph         H           CH3NHM6         Me         Me         CH3NH4         NMs         Ph <td>CH<sub>2</sub>OMe</td> <td>nPr</td> <td>CI</td> <td>CH₂OM e</td> <td>COOH</td> <td>CI</td> <td></td> <td></td> <td></td>	CH <sub>2</sub> OMe	nPr	CI	CH₂OM e	COOH	CI			
CH2NH2         H         Et         CH2NH2         CONHMe         Et         CH2NH2         Et         H           CH3NH2         H         nPr         CH2NH2         CONHMS         nPr         CH2NH2         nPr         H           CH2NH2         H         Ph         CH2NH2         NHMS         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NHM6         Me         CH2NHM6         NO2         Me         CH3NHM6         Me         H           CH2Ph         Et         Et         CH2Ph         CH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         nPr         CH2Ph         COMe         nPr         CH2Ph         nPr         H	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	₽h	Cl		CONH <sub>2</sub>	CI			
CH2NH2         H         Ph         CH2NH2         NHMS         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NH2         H         Ph         CH2NH2         NHMS         Ph         CH2NH2         Ph         H           CH2NHM6         Me         CH2NHM6         NO2         Me         CH2NHM6         Me         H           CH2Ph         Et         Et         CH2Ph         CH         Et         CH2Ph         Et         H           CH2Ph         nPr         nPr         CH2Ph         COMe         nPr         CH2Ph         nPr         H		Н	Εt	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMe				
CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> H Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> NHMS Ph CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> Ph H CH <sub>2</sub> NHMe Me CH <sub>2</sub> NHMe NO <sub>2</sub> Me CH <sub>2</sub> NHMe Me H CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph пPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	н	nPr	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CONHMs	n₽r			
CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph nPr NPr CH <sub>2</sub> Ph CMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H		н	Ph	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	NHMs	Ph			
CH <sub>2</sub> Ph Et Et CH <sub>2</sub> Ph OH Et CH <sub>2</sub> Ph Et H CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H		Мe	Me	CH <sub>2</sub> NHMe	$NO_2$				
CH <sub>2</sub> Ph nPr nPr CH <sub>2</sub> Ph COMe nPr CH <sub>2</sub> Ph nPr H		Et	Εt	CH <sub>2</sub> Ph					
		nPr	nPr		COMe	nPr			
10.40				CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	COOH	Ph	CH₂CH₂Ph	Ph	Н

【0422】 【表254】

HN-R			
HN ~	HN \	ни	ни
HN	ÓН	HN \	
HN	HN~~F	HN \	HN
HN	HN CI		F HN N
$\Omega$	HN	HN F	HN N
HN	HN	2 HN	HN S
HN \	F	Ò	HN O
HN \	HN	HN COOH	HN
HN \	HN OH	HN	HN
	HN	NH₂ HN	HN
HN		HN Me	HN N CI
HN	HN	HN	N-D
HN OH	HN		HN N
HN	HN \	HNOH	

[0423]

本発明化合物は、3位と4位に不斉炭素を有しており、該不斉炭素に基づく光学異性体 が存在するが、ラセミ体と同様に光学活性体も本発明の用途に用いることができる。又、 3位と4位の立体配置に基づくシス又はトランス異性体も包含するが、好ましくはトランス異性体である。

#### [0424]

又、塩の形成可能な化合物であるときはその医薬的に許容し得る塩も有効成分として用いることができる。

# [0425]

医薬的に許容し得る塩としては塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、メタンスルホン酸塩、 酢酸塩、安息香酸塩、酒石酸塩、リン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ 酸塩、グルコン酸塩及びサリチル酸塩等が挙げられる。

# [0426]

好ましくは、塩酸塩、マレイン酸塩及びメタンスルホン酸塩が挙げられる。

#### [0427]

次に本発明化合物の製法を説明する。

# [0428]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基である (I-a)、 (II-a) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (1) 又は式 (2) により表される化合物と化合物 (3) を不活性溶媒中反応させることにより得ることができる。

# [0429]

#### 【化19】

$$(1) \qquad (2) \qquad R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}}V^{-}(CH_{2})_{\overline{n}}R^{6}$$

$$(1) \qquad (2) \qquad R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}}V^{-}(CH_{2})_{\overline{n}}R^{6}$$

$$(1) \qquad (2) \qquad R^{5} \qquad (CH_{2})_{\overline{n}}V^{-}(CH_{2})_{\overline{n}}R^{6}$$

$$A \qquad OH \qquad R^{1} \qquad A \qquad OH \qquad R^{2} \qquad (IL_{2}) \qquad (IL_{2}) \qquad (IL_{2}) \qquad (IL_{2})$$

#### [0430]

式(1)、式(2)によって表される化合物と化合物(3)の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

#### [0431]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

#### [0432]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~100℃である。

#### [0433]

- 反応原料のモル比は、化合物 (3) /化合物 (1) 又は化合物 (2) は  $0.5\sim4.0$  の範囲であり、好ましくは  $1.0\sim2.0$  の範囲である。

#### [0434]

反応には酸触媒を用いてもよい。

[0435]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸に代表される無機酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、過塩素酸リチウム、臭化リチウム、トリフルオロメタンスルホン酸イッテルビウムに代表されるルイス酸等が挙げられる

[0436]

好ましくは、臭化リチウム、過塩素酸リチウムが挙げられる。

[0437]

一般式 (I) 、 (II) により表される化合物のうち光学活性体の合成は、ラセミ体を光学分割する方法(特開平 3-1 4 1 2 8 6 号公報、米国特許 5 0 9 7 0 3 7 号及び欧州特許 4 0 9 1 6 5 5 6 を利用することにより達成される。

[0438]

又、一般式(1)、(2)により表される化合物の合成は、以下の合成法を利用することにより達成される。

[0439]

○ベンゾピラン環一般合成法

既知の方法(J. M. Evans ら、J. Med. Chem. 1984, 27, 1127、J. Med. Chem. 1986, 29, 2 194、J. T. NorthらJ. Org. Chem. 1995, 60, 3397や、特開昭 5 6 - 5 7 7 8 5 号公報、特開昭 5 6 - 5 7 7 8 6 号公報、特開昭 5 8 - 1 8 8 8 8 0 号公報、特開平 2 - 1 4 1 号公報、特開平 1 0 - 8 7 6 5 0 号広報及び特開平 1 1 - 2 0 9 3 6 6 号広報等に記載の方法)に従って合成することができる。

[0440]

○インドール、オキシインドール

- T. Sakamoto, et al., Heterocycles, 1986, 24, 31.
- M.Belley, et.al., Synthesis, 2001, 222.
- A.D.Cross, et al., J. Chem. Soc., 1961, 2714.

○イミダゾリノン

J.Kitteringham, et.al., Synthetic Commun., 2000, 30, 1937.

○キノリン

- S. Imor, et al., Synthetic Commun., 1996, 26, 2197.
- Y. Kitahara, et al., Tetrahedron, 1997, 53, 6001.
- A.G. Osborne, et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1993, 181.
- R. T. Shuman, et al., J. Org. Chem., 1990, 55,738.
- T. Sakamoto, et al., Chem. Pharm. Bull., 1981, 29,2485.
- Y. Tsuji, et al., J. Org. Chem., 1987, 52, 1673.
- Z. Song, et al., J. Heterocyclic Chem., 1993, 30,17.

○キノリノン

- M.R.Sabol, et al., Synthetic Commun., 2000, 30, 427.
- Z-Y. Yang, et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40, 4505.

H-BSun, et al., Synthesis, 1997, 1249.

- A. Guiotto, et al., J. Heterocyclic Chem. 1989, 26, 917.
- K. Konno, et al., Heterocycles 1986, 24,2169.
- E. Fernandez, et al., Synthesis 1995, 1362.

○ベンゾチアゾール、トリアゾール、

- N.B. Ambati, et al., Synthetic Commun., 1997, 27, 1487.
- D.E.Burton., et al., J. Chem. Soc (C). 1968, 1268.

○キノキサリン、キノキサリノン

- J.H.Liu, et al., J. Org. Chem., 2000, 65, 3395.
- J.J.Li, et al., Tetrahedron Lett., 1999, 40,4507.
- Y. Ahmed, et al., Bull. Chem. Soc. Jpn., 1987, 60, 1145.

# ○ベンズオキサジノン

G.H.Jones, et al., J. Med. Chem., 1987, 30,295.

J.L. Wright, et al., J. Med. Chem., 2000, 43,3408.

M. Kluge, et al., J. Heterocyclic Chem., 1995, 32,395.

一般式 (1) 又は (2) で表される化合物のうち、Aが式 (5) であり、R  $^4$  が水素原子であり、R  $^3$  が水酸基である (1-a)、 (2-a) で表される化合物は、一般式 (6) 又は式 (7) により表される化合物から既知の方法 (J. M. Evansら、J. Med. Chem. 1984, 27, 1127、J. Med. Chem. 1986, 29, 2194、J. T. NorthらJ. Org. Chem. 1995, 60, 33 97や、特開昭 56-57785 号公報、特開昭 56-57785 号公報、特開昭 58-188885 号公報、特開平 2-141 号公報、特開平 10-8765 0号広報及び特開平 11-20936 6号広報等に記載の方法)により得ることができる。

# [0441]

【化20】

## [0442]

式 (6), (7) であらわされる化合物は化合物 (8) と化合物 (9) を反応させることにより得ることもできる。(参考文献 Y. Tsuji ら, J. Org. Chem., 1987,52, 1673.)

# [0443]

# 【化21】

#### [0444]

式(8)によってあらわされる化合物と化合物(9)の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

#### [0445]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキ シエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル によって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンに よって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

#### [0446]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~200℃である。

# [0447]

反応原料のモル比は、化合物 (8) /化合物 (9) は  $0.1 \sim 4.0$  の範囲であり、好ましくは  $0.5 \sim 2.0$  の範囲である。

#### [0448]

反応には遷移金属触媒と配位子を用いても良い

用いる遷移触媒としては、塩化ルテニウム、ジクロロトリストリフェニルホスフィンルテニウム、ジブロモトリストリフェニルホスフィンルテニウム、ジヒドリドテトラキストリフェニルホスフィンルテニウム、( $\eta$ 4-シクロオクタジエン)( $\eta$ 6-シクロオクタトリエン)ルテニウム、ジクロロトリカルボニルルテニウムダイマー、ドデカカルボニルトリルテニウム、( $\eta$ 5-ペンタメチルシクロペンタジエニル)クロロ( $\eta$ 4-シクロオクタトリエン)ルテニウム、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、ジクロロビストリフェニルホスフィンパラジウム、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、ビスジベンジリデンアセトンパラジウム、塩化ロジウム、クロロトリストリフェニルホスフィンロジウム、ヒドリドカルボニルトリストリフェニルホスフィンロジウム、ヒドリドトリストリフェニルホスフィンロジウム、ジー $\mu$ -クロロテトラカルボニルニロジウム、クロロカルボニルビストリフェニルホスフィンイリジウム、( $\eta$ 5-ペタメチルシクロペンタジエニル)ジクロロイリジウムダイマー、ニッケルテトラキストリフェニルホスフィン、ジコバルトオクタカルボニル、( $\eta$ 5-シクロペンタジエニル)ジカルボニルコバルト等が挙げられ。

## [0449]

好ましくは塩化ルテニウムが挙げられる。

#### [0450]

配位子としてはトリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリn-プロピルホスフィン、トリi-プロピルホスフィン、トリn-ブチルフォスフィン、トリt-ブチルフォスフィン、トリシクロへキシルホスフィン、トリフェニルホスフィン、トリ (o-トリル) ホスフィン、トリシクロへキシルホスフィン、トリフェニルホスフィン、トリ (o-トリル) ホスフィンに代表される単座ホスフィン系配位子、1,2-ビスジフェニルホスフィノエタン、1,3-ビスジフェニルホスフィノブタン、1,2-ジエチルホスフィノエタンに代表される2座ホスフィン系配位子、トリエチルホスファイト、トリブチルホスファイト、トリフェニルホスファイト、トリ(o-トリル) ホスファイトに代表されるホスファイト配位子が挙げられる。

# [0451]

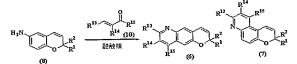
好ましくはトリウェニルホスフィン、トリn-ブチルフォスフィン、トリt-ブチルフォスフィンが挙げられる。

## [0452]

式 (6), (7) であらわされる化合物は化合物 (8) と化合物 (10) を酸触媒存在下反応させることによっても得ることができる。(参考文献 Y. Kitaharaら、Tetrahedron Lett.1997, 53, 6001.、Z. Song ら J. Heterocyclic Chem., 1993, 30, 17.)

# [0453]

【化22】



#### [0454]

式(8)によってあらわされる化合物と化合物(10)の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

## [0455]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテルによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、酢酸、トリフルオロ酢酸に代表される

有機酸系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましく はエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒、有機酸系溶媒が挙げられる。

#### [0456]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸、硝酸、リン酸に代表される無機酸、メタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸に代表される有機スルホン酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、塩化亜鉛、臭化亜鉛、ヨウ化亜鉛、塩化鉄(II)、塩化鉄(II)、塩化銅(I)、塩化銅(II)に代表されるルイス酸が挙げられる。好ましくは、塩酸、塩化亜鉛が挙げられる。

## [0457]

反応に用いる反応温度は、通常-80 Cから用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10 C  $\sim 200$  C である。

#### [0458]

反応原料のモル比は、化合物(10)/化合物(8)は $1\sim10$ の範囲であり、好ましくは $1\sim3$ の範囲である。

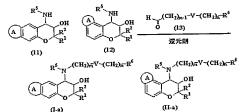
# [0459]

又、一般式(1)、(2)により表される化合物の光学活性体の合成は、不斉合成による方法(特表平5-507645号公報、特開平5-301878号公報、特開平7-285983号公報、欧州特許535377号及び米国特許5420314号)を利用することにより達成される。

# [0460]

一般式 (I) 又は (II) で表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基である (I-a)、 (II-a) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (11) 又は式 (12) により表される化合物と化合物 (13) を不活性溶媒中還元的アミノ化反応させることによっても得ることができる。

# 【0461】 【化23】



## [0462]

式 (11)、式 (12) によって表される化合物と化合物 (13) の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

## [0463]

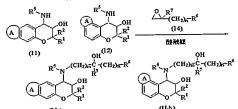
ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、上記溶媒を任意に混合した条件や無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

#### [0464]

一般式 (I) 又は (II) で表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基であり、mが1であり、VがC  $R^7$  O Hである (I-b) 、 (I I-b) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (1 1) 又は式 (1 2) により表さ

れる化合物と化合物(14)を不活性溶媒中反応させることによっても得ることができる

# 【0465】 【化24】



[0466]

式 (11)、式 (12) によって表される化合物と化合物 (14) の反応に用いる溶媒 としては下記のものが挙げられる。

#### [0467]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはエーテル系溶媒、ニトリル系溶媒、アルコール系溶媒が挙げられる。

# [0468]

反応温度は、通常-80℃から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10℃~100℃である。

## [0469]

反応原料のモル比は、化合物(14)/化合物(11)又は化合物(12)は $0.5\sim4.0$ の範囲であり、好ましくは $1.0\sim2.0$ の範囲である。

#### [0470]

反応には酸触媒を用いてもよい。

# [0471]

用いる酸触媒としては、塩酸、硫酸に代表される無機酸、塩化アルミニウム、四塩化チタン、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、過塩素酸、過塩素酸リチウム、臭化リチウム、トリフルオロメタンスルホン酸イッテルビウムに代表されるルイス酸等が挙げられる

#### [0472]

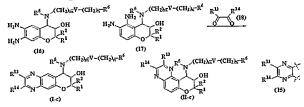
好ましくは、臭化リチウム、過塩素酸リチウムが挙げられる。

#### [0473]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基、A が式 (15) の (I-c)、 (II-c) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式 (16) 又は式 (17) により表される化合物と化合物 (18) を不活性溶媒中、反応させることによっても得ることができる。

#### [0474]

#### 【化25】



## [0475]

式 (16)、式 (17) によって表される化合物と化合物 (18) の反応に用いる溶媒としては下記のものが挙げられる。

#### [0476]

ジメチルスルホキシドによって代表されるスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミド 又はジメチルアセトアミドによって代表されるアミド系溶媒、エチルエーテル、ジメトキシエタン又はテトラヒドロフラン、ジオキサンによって代表されるエーテル系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタンによって代表されるハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリルによって代表されるニトリル系溶媒、ベンゼン、トルエンによって代表される芳香族炭化水素系溶媒、ヘキサン、ヘプタンによって代表される炭化水素系溶媒、酢酸エチルによって代表されるエステル系溶媒、メタノール、エタノール、1ープロパノール、2ープロパノール、エチレングリコールによって代表されるアルコール系溶媒、水が挙げられる。又、上記溶媒を任意に混合した条件や無溶媒の条件で反応を行うこともできる。好ましくはアルコール系溶媒が挙げられる。

#### [0477]

反応温度は、通常-80  $\mathbb{C}$ から用いられる反応溶媒の還流温度までであり、好ましくは、-10  $\mathbb{C}$   $\sim 50$   $\mathbb{C}$  である。

# [0478]

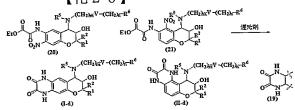
反応原料のモル比は、化合物(18)/化合物(16)又は化合物(17)は $0.5\sim4.0$ の範囲であり、好ましくは $0.8\sim2.0$ の範囲である。

## [0479]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基、Aが式(19)の(I-d)、(I I-d)で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式(20)又は式(21)により表される化合物を不活性溶媒中、還元反応させることによっても得ることができる。

## [0480]

# 【化26】



#### [0481]

一般式 (I)、(II) によって表される化合物のうち、 $R^4$  が水素原子であり、 $R^3$  が水酸基、A が式  $(2\,2)$  (X が S  $O_2$  又はC O であり、Y が S 又はO である。)であり(I -e)、(I I -e) で表される化合物は、下記の反応式によって示されるように、一般式  $(2\,3)$  又は式  $(2\,4)$  により表される化合物を不活性溶媒中、塩基性条件で閉環させることによっても得ることができる。

# [0482]

# 

#### [0483]

一般式 (I)、 (II) によって表される化合物のうち、  $(I-a\sim e)$ 、  $(II-a\sim e)$ で表される化合物に含まれない化合物  $(R^3 \ ER^4 \$ が一緒になって結合を意味する化合物及び  $R^4 \$ が水素原子であり、  $R^3 \$ が  $C_{1-6} \$  アルキルカルボニルオキシ基である化合物)は特開昭 52-91866 号公報及び特開平 10-87650 号公報等に記載の製造法と同様な方法により製造することができる。

# [0484]

前述したように、本発明者らは一般式(I)、(II)で表わされる化合物には強い不応期延長作用を有していることを見い出した。不応期延長作用は抗不整脈作用の奏功機序の1つであり、臨床の不整脈に対する有効性を外挿しうる重要な指標である。不応期延長作用を主たる機序とする従来の抗不整脈薬(例えばVaughanWilliamsによる抗不整脈薬分類の第3群に属するdーソタロールなど)は、不応期延長作用と関連のある心室筋活動電位の延長に基づくtorsadesde pointes等の突然死を誘発しうる極めて危険な不整脈誘発作用が重大な課題とされており、心房筋が主体の不整脈(上室性頻拍症、心房粗動、心房細動など)に対する治療の問題になっている。

#### [0485]

この課題を解決するために本発明者らは、心室筋よりも心房筋に選択的な不応期延長作用を有する化合物の探索研究を実施し、一般式(I)又は(II)で表される化合物に、心室筋の不応期および活動電位に影響することなく心房筋に選択的な不応期延長作用があることを見出した。本発明者らの発見の既存技術との違いは、これらの化合物群に対して心房筋に選択的な不応期延長作用を付与し得たところにあり、このことは、摘出した心室筋の活動電位持続時間に影響しないこと、および麻酔動物の心電図QTに影響を及ぼさないことによっても示されている。以上のことから、本化合物は心室筋における不整脈誘発作用を持ち合わせず、既存技術に比べて心房筋が主体の不整脈においてより安全な使用に貢献できる可能性を提供しうるものである。この技術は、心房性不整脈に係わる、例えば発作性、慢性、手術前、手術中あるいは手術後の抗心房細動剤、抗心房粗動剤、抗心房性頻脈剤としての治療あるいは予防的な利用、心房性不整脈に基づく塞栓症への進展予防、心房性不整脈あるいは頻脈での移行の予防、心室性不整脈あるいは頻脈に移行しうる心房性不整脈あるいは頻脈での移行の予防、心室性不整脈あるいは頻脈に移行しうる心房性不整脈あるいは頻脈で防作用に基づく生命予後悪化の予防の目的として有用である。

#### [0486]

本発明は、これらの治療に一般式(I)、(II)で表わされる化合物の有効な量を含む医薬組成物又は獣医薬組成物を提供する。

## [0487]

本発明に係る化合物の投与形態としては、注射剤(皮下、静脈内、筋肉内、腹腔内注射)、軟膏剤、坐剤、エアゾール剤等による非経口投与又は錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤、シロップ剤、液剤、乳剤、懸濁液剤等による経口投与をあげることができる。

#### [0488]

本発明に係る化合物を含有する上記の医薬的又は獣医薬的組成物は、全組成物の重量に対して、本発明に係る化合物を約0.01~99.5%、好ましくは、約0.1~30%を含有する。

#### [0489]

本発明に係る化合物に又は該化合物を含有する組成物に加えて、他の医薬的に又は獣医薬的に活性な化合物を含ませることができる。

[0490]

また、これらの組成物は、本発明に係る化合物の複数を含ませることができる。

#### [0491]

本発明化合物の臨床的投与量は、年令、体重、患者の感受性、症状の程度等により異なるが、通常効果的な投与量は、成人一日0.003~1.5g、好ましくは、0.01~0.6g程度である。しかし必要により上記の範囲外の量を用いることもできる。

## [0492]

本発明化合物は、製薬の慣用手段によって投与用に製剤化される。

#### [0493]

即ち、経口投与用の錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤は、賦形剤、例えば白糖、乳糖、ブドウ糖、でんぷん、マンニット;結合剤、例えばヒドロキシプロピルセルロース、シロップ、アラビアゴム、ゼラチン、ソルビット、トラガント、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン;崩壊剤、例えばでんぷん、カルボキシメチルセルロース又はそのカルシウム塩、微結晶セルロース、ポリエチレングリコール;滑沢剤、例えばタルク、ステアリン酸マグネシウム又はカルシウム、シリカ;潤滑剤、例えばラウリル酸ナトリウム、グリセロール等を使用して調製される。

# [0494]

注射剤、液剤、乳剤、懸濁剤、シロップ剤及びエアゾール剤は、活性成分の溶剤、例えば水、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、プロピレングリコール、1,3ーブチレングリコール、ポリエチレングリコール;界面活性剤、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、水素添加ヒマシ油のポリオキシエチレンエーテル、レシチン;懸濁剤、例えばカルボキシメチルナトリウム塩、メチルセルロース等のセルロース誘導体、トラガント、アラビアゴム等の天然ゴム類;保存剤、例えばパラオキシ安息香酸のエステル、塩化ベンザルコニウム、ソルビン酸塩等を使用して調製される。

#### [0495]

経皮吸収型製剤である軟膏には、例えば白色ワセリン、流動パラフィン、高級アルコール、マクロゴール軟膏、親水軟膏、水性ゲル基剤等が用いられる。

#### [0496]

坐剤は、例えばカカオ脂、ポリエチレングリコール、ラノリン、脂肪酸トリグリセライド、ココナット油、ポリソルベート等を使用して調製される。

#### 【実施例】

#### [0497]

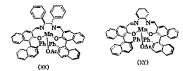
以下、本発明を実施例にて詳述するが、本発明は、これらの実施例に何ら限定されるものではない。

#### [0498]

尚、Ph, Phサレンマンガン錯体(XX)、Cyc, Phサレンマンガン錯体(XY)とは以下の構造式で示される光学活性化合物を意味し、特開平 7-285983 号公報記載の方法に順次じて合成したものを用いた。

#### [0499]

#### 【化28】



## [0500]

#### 合成例1

1,2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

# [0501]

【化29】

HN OH 3/2 CO<sub>2</sub>H

[0502]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0503]

【化30】



[0504]

6-アミノ-2, 2-ジメチルクロメン(10.1g, 57.7mmo1)のエタノール溶液(500mL)に室温でメチルビニルケトン(33.0mL, 404mmo1)、m-ニトロベンゼンスルホン酸(21.1g, 104mmo1)、塩化亜鉛(1.97g, 14.4mmo1)、35%塩酸(24mL, 289mmo1)を加え、110℃で5時間攪拌した。反応終了後、エタノールを留去し、水を加え、炭酸水素ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出し、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物(収率38%)を得た。

褐色無定形

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \delta$ ; 1.51(s, 6H), 2.59(d, J =0.6 Hz, 3H), 5.90(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6, 59(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.11(d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.25(s, 1H), 7.68(s, 1H), 8.57(d, J = 4.4 Hz, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 226[M+1]^{+}$ 

[0505]

2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール

[0506]

【化31】



[0507]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(530mg, 2.35mmol)のジメチルスルホキシド溶液(8mL)に室温でN-プロモサクシンイミド(920mg,5.17mmol)、水(1.6mL)を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水層に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、さらに酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を留去し、3-プロモ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-4-オールの粗物を得た。室温で1,4-ジオキサン(30mL)、1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(5.64mL)を加え、室温で2.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去することで、3,4-エポキシ-2,2,5-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリンの粗物を得た。室温で残渣に1,4-ジオキサン(3.2mL)、過塩素酸リチウム(250mg,2,35mmol)、2-フェニルエチルアミン(0.35mL,2.82mmol)を加え、75℃で5時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液に炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(3段階 収率26%)を得た。

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.26(s, 3H), 1.55(s, 3H), 2.59(s, 3H), 2.83(t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.96-3.12(m, 3H), 3.60(d, J =10.5 Hz, 1H), 3.88(dd, J = 1.1 Hz, 10.5 Hz, 1H), 7.13(d, J = 4.2Hz, 1H), 7.18-7.32(m, 6H), 7.98(d, J = 1.1 Hz, 1H), 8.60(d, J =4.4 Hz, 1H), 8.

Hz, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}$ 

[0508]

2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール(219mg, 0.60mmol)の酢酸エチル溶液(3mL)にマレイン酸(77mg, 0.66mmol)の酢酸エチル(1 mL)溶液を滴下し、反応液を0  $\infty$  に冷却しヘキサン(10mL)を加え、析出した固体を濾過することにより2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩(収率72%)を得た。

黄色結晶

mp.;172-174℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$   $\delta$  ; 1.17(s, 3H), 1.50(s, 3H), 2.59(s, 3H), 2.94-3.37(m, 4H), 4.10 (dd, J = 6.1 Hz, 9.4 Hz, 1H), 4.72(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.09(s, 3H), 6.33(d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.23-7.35(m, 6H), 7.42(s, 1H), 8.43(s, 1H), 8.66(d, J = 4.1 Hz, 1H)

[0509]

合成例 2

2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール

[0510]

【化32】



[0511]

合成例1の方法に準拠して合成した。

[0512]

2.2.7.9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0513]

【化33】



[0514]

(収率59%)

黒褐色油状物

 $^{1}$ H-NMR(CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ ; 1.49(s, 6H), 2.54(s, 3H), 2.62(s, 3H), 5.86(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6,55(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.00(s, 1H), 7.20(s, 1H), 7.60(s, 1H) MS(ESI<sup>+</sup>)m/z;240[M+1]<sup>+</sup>

[0515]

3-ブロモ-2, 2, 7, 9-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン-4-オール

[0516]

【化34】



[0517]

(収率82%)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.47(s, 3H), 1.68(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.70(s, 3H), 4.28(d, J = 9.6 Hz, 1H), 5.14(d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 7.28(s, 1H), 8.37(s, 1H) MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 336,338 [M+1]<sup>+</sup>

[0518]

2, 2, 7, 9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]

```
キノリン-3-オール(収率17%)
白色結晶
mp.;144-147℃
^{1}H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) \delta; 1.25(s, 3H), 1.54(s, 3H), 1.90(br s, 1H), 2.55(s, 3H), 2.65(s,
3H), 2.81(t, J = 6.8 \text{ Hz}, 2H), 2.97-3.10(m, 2H), 3.19(br s, 1H), 3.58(d, J = 10.5
Hz, 1H), 3.85(d, J=10.5 Hz, 1H), 7.04(s, 1H), 7.17-7.31(m, 6H), 7.91(s, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 377[M+1]<sup>+</sup>
MS(ESI-)m/z; 421 [M+45]^+
   [0519]
合成例3
2,2,8,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]
キノリン-3-オール 1マレイン酸塩
   [0520]
     【化35】
   [0521]
  合成例1の方法に準拠して合成した。
   [0522]
2,2,8,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン
   [0523]
     【化36】
   [0524]
(収率50%)
^{1}H-NMR(CDC1<sub>3</sub>) \delta; 1.50(s, 6H), 2.50(s, 3H), 2.66(s, 3H), 5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H),
 6,57(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.26(s, 1H), 7.63(s, 1H), 8.48(s, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 240[M+1] +
   [0525]
3-ブロモ-2, 2, 7, 9-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-4-オール
   [0526]
     【化37】
   [0527]
(収率65%)
^{1}H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) \delta; 1.48(s, 3H), 1.69(s, 3H), 1.80(br s, 1H), 2.46(s, 3H), 2.56(s,
3H), 4.28(d, J = 9.6 \text{ Hz}, 1\text{H}), 5.15(d, J = 9.6 \text{ Hz}, 1\text{H}), 7.25(s, 1\text{H}), 8.42(s, 1\text{H}),
8.57(s, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 336,338 [M+1] +
   [0528]
2,2,8,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]
キノリン-3-オール 1マレイン酸塩
(収率4%)
白色結晶
mp.;199-203℃
^{1}H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) \delta; 1.17(s, 3H), 1.50(s, 3H), 2.41(s, 3H), 2.49(s, 3H), 2.89-3.40
```

(m, 4H), 4.07(dd, J = 5.5 Hz, 9.4 Hz, 1H), 4.66(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.28(d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.22-7.35(m, 5H), 7.43(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.59(s, 1H)

MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 377[M+1] <sup>+</sup> MS(ESI-)m/z; 421 [M+45] <sup>+</sup>

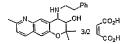
[0529]

合成例4

2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

[0530]

【化38】



[0531]

2,2,7-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0532]

【化39】



[0533]

6-アミノ-2,2-ジメチルクロメン(1.00g,5.71mmol)に室温で35%塩酸(1.43mL,17.1mmol), p-クロラニル(1.40g,5.71mmol)、n-ブタノール(1.3mL)を加え、120 に昇温した。クロチルアルデヒド(0.567mL,6.84mmol)のn-ブタノール溶液(0.52mL)を添加し、120 で20分攪拌した。塩化亜鉛(0.777g,5.71mmol)のテトラヒドロフラン溶液(10mL)を添加し、120 でで20分攪拌した。反応終了後、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、酢酸エチルから再結晶することにより、目的物(収率22%)を得た。

灰色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.48(s, 6H), 2.67(s, 3H), 5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6,55(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.05(s, 1H), 7.16(d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.64(s, 1H), 7.86(d, J = 8.5 Hz, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z$ ; 226[M+1] +

MS(ESI-)m/z; 225 [M] +

[0534]

 $\bar{3}$ -  $\bar{7}$  ロモ-2,  $\bar{2}$ ,  $\bar{7}$ -トリメチル-3,  $\bar{4}$ -ジヒドロ-2H-ピラノ[2,  $\bar{3}$ -g] キノリン-4-オール

[0535]

【化40】



[0536]

合成例1の方法に準拠して合成した。

(収率24%)

[0537]

2,2,7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 3/2マレイン酸塩

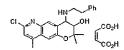
(収率12%)

白色結晶

 ${}^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6}) \ \delta \ ; \ 1.15(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 1.48(\text{s}, \ 3\text{H}), 2.63(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 2.70-3.38(\text{m}, \ 4\text{H}), \ 4.09(\text{dd}, \ J = 5.8 \ \text{Hz}, \ 9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 4.68(\text{d}, \ J = 9.4 \ \text{Hz}, \ 1\text{H}), \ 6.08(\text{s}, \ 3\text{H}), \ 6.29(\text{d}, \ J = 5.8 \ \text{Hz})$ 

.8 Hz, .1 H), 7.22 - 7.35 (m), .6 H), .7.40 (s), .10 (d), .1 $MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}$ MS(ESI-)m/z; 407 [M+45] +[0538] 合成例 5 2,2,8-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノ リン-3-オール 2マレイン酸塩 [0539] 【化41】 [0540]合成例5は合成例4の方法に準拠して合成した。 [0541]2,2,8-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン [0542]【化42】 [0543](収率17%)  $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.48(s, 6H), 2.45(s, 3H), 5.87(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.56(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.00(s, 1H), 7.64(s, 1H), 7.70(s, 1H), 8.54(d, J = 8.5 Hz, 1H) $MS(ESI^{+})m/z$ ; 226[M+1] + [0544]3-ブロモ-2, 2, 8-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-4-オール [0545]【化43】 [0546](収率54%)  $MS(ESI^{+})m/z; 322,324 [M+1]^{+}$ [0547]2, 2, 8-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノ リン-3-オール 2マレイン酸塩 (収率20%) 白色結晶  $^{1}$ H-NMR(DMSO-d6)  $\delta$ ; 1.15(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.45(s, 3H), 2.97-3.39(m, 4H), 4.09 (dd, J = 6.1 Hz, 9.4 Hz, 1H), 4.71(d, J = 9.1 Hz, 1H), 6.15(s, 4H), 6.32(d, J = 6.1 Hz).3 Hz, 1H),7.19-7.36(m, 5H), 7.97(s, 1H), 8.39(s, 1H), 8.67(s, 1H) [0548]合成例6 7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩 [0549]

【化44】



[0550]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(1.56g,6.92mmo1)のクロロホルム溶液(1.5.6mL)に、室温でm-クロロ過安息香酸(2.61g,15.2mmo1)のクロロホルム(6.4mL)-メタノール(1.6mL)溶液を滴下し、室温で1.5時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、室温で残渣にクロロホルム(3.3mL)、パラトルエンスルホン酸塩化物(1.32g,6.92mmo1)、炭酸カリウム(0.954g,6.92mmo1)を加え、70Cで3時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、クロロホルムで抽出、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(へキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、目的物(収率67%)を得た。

[0551]

【化45】



[0552]

淡黄色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$  &; 1.42(s, 6H), 2.48(d, J= 0.8 Hz, 3H), 5.83(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.47(d, J= 9.9 Hz, 1H), 7.03(d, J= 3.6 Hz, 1H), 7.11(s, 1H), 7.50(s, 1H) MS(ESI^+)m/z; 260[M+1]  $^{+}$ 

[0553]

3-ブロモ-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-4-オール

[0554]

【化46】



[0555]

以下、合成例1の方法を準拠して合成した。

(収率44%)

 $MS(ESI^{+})m/z$ ; 356,358 [M+1] +

[0556]

7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(収率58%)

白色結晶

mp.;221-226℃(分解)

 $^{1}$ H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ ; 1.17(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.93-3.32(m, 4H), 4.05 (m, 1H), 4.65(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.28(br s, 1H), 7.22-7.34(m, 5H), 7.43(s, 2H), 8.32(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 397[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 441 [M+45] +

[0557]

合成例7

3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

【0558】 【化47】

NC N HN OH CO<sub>2</sub>H

[0559]

2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル

[0560]

【化48】



[0561]

淡黄色固体

 $^{1}$ H-NMR(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ; 1.52(s, 6H), 2.62(d, J= 0.6 Hz, 3H), 5.97(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.58(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.23(s, 1H), 7.40(s, 1H), 7.71(s, 1H) MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 251[M+1]  $^{+}$ 

[0562]

3- ブロモ-4-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-7-カルボニトリル

[0563]

【化49】



[0564]

以下、合成例1の方法を準拠し合成した。

(収率36%)

 $MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}$ 

[0565]

3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

白色結晶

mp.;218-220℃(分解)

 $^{1}$  H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  ; 1.20(s, 3H), 1.51(s, 3H), 2.65(s, 3H), 2.96-3.33(m, 4H), 4.04 -4.06(m, 1H), 4.64(br s, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29 (br s, 1H), 7.25-7.31(m, 5H), 7.5 0(s, 1H), 7.85(s, 1H), 8.49(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 388[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 432 [M+45] +

[0566]

合成例 8

3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール

【0567】 【化50】

HN OH

【0568】

6-[(1,1-ジメチル-2-プロピニル)オキシ]キノリン

[0569]

【化51】



[0570]

2-メチル3-ブチン-2-オール (2. 45mL, 25. 1mmo1)、 1, 8-ジアザビシクロ-[5,4,0]-7-ウンデセン (4. 25mL, 28. 4mmo1)のアセトニトリル溶液 (15. 5mL)を0℃で30分攪拌し、無水トリフルオロ酢酸 (3. 55mL, 25. 1mmo1)を滴下した。この混合液を、0℃で6-ヒドロキシキノリン (2. 43g, 16. 7mmo1)、塩化銅 (1) (8. 3mg, 0. 0835mmo1)、アセトニトリル (15. 5mL)、1. 8-ジアザビシクロ-[5,4,0]-7-ウンデセン (4. 25mL, 28. 4mmo1)の混合溶液に滴下し、0℃で3時間攪拌した。1mo1/LHC1で酸性にし、酢酸エチルで抽出し、水層を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー (6+サン/酢酸エチル=1/1-1/3)で精製し、目的物を得た

## 淡黄色結晶

mp.:65−67 $^{\circ}$ C

 $^{1}$ H-NMR(CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ; 1.86(s, 6H), 2.70(s, 1H), 7.69-7.71(2H), 7.80(s, 1H), 8.33(d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.45(d, J = 8.3 Hz 1H), 9.01(br s, 1H)

MS(GC)m/z; 211 [M] +

[0571]

3, 3-ジメチル-3H-ピラノ[3, 2-f]キノリン

【0572】 【化52】

**1**10



[0573]

6-[(1,1-i)メチル-2-プロピニル)オキシ]キノリン (16.7mmol)の1,2-ジクロロベンゼン溶液(10mL)を180 $\mathbb C$ で1時間攪拌した。反応終了後、溶媒を留去し、残渣をヘキサン-酢酸エチルから再結晶し、目的物(2段階quant.)を得た。

#### 緑色結晶

mp.:104-107℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.54(s, 6H), 5.89(d, J= 10.2 Hz, 1H), 6.93(d, J= 10.2 Hz, 1H) , 7.50(d, J= 9.1 Hz, 1H), 7.73(br s, 1H), 8.31(d, J= 9.1 Hz, 1H), 8.74(d, J= 8.5 Hz, 1H), 9.03(br s, 1H)

MS(GC)m/z; 211[M] +

[0574]

3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-2-オール

以下、合成例1の方法に準拠し合成した。

白色結晶

mp.:180-182℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.32(s, 3H), 1.44(s, 3H), 1.63(br s, 1H), 2.43(br s, 1H), 2.69–2.84(m, 3H), 2.92–2.97(m, 1H), 3.83(d, J= 5.0 Hz, 1H), 4.09(d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.10–7.29(m, 6H), 7.86(d, J= 9.1 Hz, 1H), 8.13(d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.71(dd, J =

```
1.7 Hz, 4.1Hz, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}
MS(ESI-)m/z; 393 [M+45] +
  [0575]
合成例9
8-クロロ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]
キノリン-2-オール
   [0576]
    【化53】
   [0577]
  3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリンを用い、合成例6と同様に合成した。
   [0578]
8-クロロ-3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリン
   [0579]
    【化54】
   [0580]
(収率82%)
赤褐色油状物
^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \delta; 1.49(s, 6H), 5.77(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.87(d, J= 9.9 Hz, 1H),
7.27(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.34(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.80(d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.19(d)
, J = 8.8 \text{ Hz}, 1\text{H})
MS(ESI^{+})m/z; 246[M+1] +
   [0581]
2-ブロモ-8-クロロ-3, 3-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-1-オール
   [0582]
     【化55】
   [0583]
 (収率45%)
   [0584]
8-クロロ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]
キノリン-2-オール
 (収率60%)
白色結晶
mp.:141-143℃
^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \delta; 1.28(s, 3H), 1.44(s, 3H), 1.64(br s, 2H), 2.65-2.78(m, 3H), 2.8
6-2.96(m, 1H), 3.84(d, J = 6.1 Hz, 1H), 4.06(d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.08-7.30(m, 7H)
 7.98(d, J = 9.1Hz, 1H), 8.22(d, J = 8.8 Hz, 1H)
MS(ESI^{+})m/z; 383[M+1]^{+}
MS(ESI-)m/z; 427 [M+45] +
   [0585]
 合成例10
```

2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボニトリル [0586] 【化56】 [0587] 3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリンを用い合成例7と同様の方法で合成した。 [0588] 3,3-ジメチル-3H-ピラノ[3,2-f]キノリン-8-カルボニトリル [0589]【化57】 [0590] (収率 quant.) 黄色固体  $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.52(s, 6H), 5.80(d, J= 9.9 Hz, 1H), 6.89(d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.37(d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.65(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.95(d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.64(d, J = 9.4 Hz,d. J = 8.8 Hz, 1H)  $MS(ESI^{+})m/z; 237[M+1]^{+}$ MS(ESI-)m/z; 235 [M-1] + [0591]2-ブロモ $_1$ -ヒドロキシ $_3$ ,3-ジメチル $_2$ ,3-ジヒドロ $_1$ H-ピラノ $_3$ ,2- $_1$ 1キノリン $_2$ 8-カル ボニトリル [0592]【化58】 [0593](収率49%)  $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.50(s, 3H), 1.69(s, 3H),2.72(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.35(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.35(d, J = 4.1 Hz, 1H), 7.2 Hz, 1H), 5.43 (dd, J = 3.9 Hz, 7.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 9.1 Hz= 8.8Hz, 1H), 8.03(d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.72(d, J = 8.5 Hz, 1H)  $MS(ESI^{+})m/z$ ; 333, 335 [M+1] <sup>+</sup> MS(ESI-)m/z; 379 [M+45] +[0594]2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボニトリル (収率72%) 白色結晶 mp.:93-96℃  $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.30(s, 3H), 1.46(s, 3H),1.60(br s, 3H), 2.13(br s, 1H), 2.66-2.79(m, 3H), 2.88-2.98(m, 1H), 3.87(d, J=5.8 Hz, 1H), 4.08(d, J=6.1 Hz, 1H), 7.09(d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.10(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.23-7.27(m, 3H), 7.30(d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.23-7.27(m, 3H), 7.30(d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.30(d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.4 Hz, 1H).1 Hz, 1H), 7.41(d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.92(d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.38(d, J = 8.5 Hz, 1Hz)

1H)

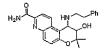
MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 374[M+1] <sup>+</sup> MS(ESI-)m/z; 418 [M+45] <sup>+</sup>

[0595]

合成例11

2-ビドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]キノリン-8-カルボキサミド

【0596】



[0597]

2-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-1f]キノリン-8-カルボキサミド

2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル)アミノ]-2,3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3,2-f]キノリン-8-カルボニトリル(400mg,1.07mmol)のt-ブタノール溶液(40mL)に室温で水酸化カリウム(800mg,14.3mmol)を加え、90度で2時間攪拌した。反応終了後、反応液に塩化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、ヘキサン-酢酸エチルから再結晶することにより、目的物(収率54%)を得た。

# 白色結晶

mp.:197-199℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.32(s, 3H), 1.47(s, 3H),1.71(br s, 2H), 2.29(br s, 1H), 2.69–2.76(m, 3H), 2.89–2.97(m, 1H), 3.86(br s, 1H), 4.13(d, J = 5.8 Hz, 1H), 5.62(br s, 1H), 7.10(d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.10(d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.20–7.28(m, 4H), 7.89(d, J = 9.4Hz, 1H), 7.98(br s, 1H), 8.07(d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.31(d, J = 8.8Hz, 1H)

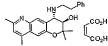
MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 392[M+1] <sup>+</sup> MS(ESI-)m/z; 436 [M+45] <sup>+</sup>

[0598]

合成例12

 $(3R^*,4S^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-7x-2)x+2)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

【0599】 【化60】



[0600]

 $(3R^*, 4R^*)$  -3, 4-エポキシ-2, 2, 7, 9-テトラメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン

【0601】 【化61】



[0602]

2,2,7,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(4.64g,19.4mmol)の酢酸エチル溶液(70mL)に、室温でN-メチルイミダゾール(0.303mL,3.88mmol)、Ph,Ph サレンマンガン錯体(201mg,0.194mmol)を加え、水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(25.6g,1.513mol/kg,38.8mmol)を滴下し、水浴中1時間攪拌した。さらに水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(2

5.6g, 1.513mol/kg, 38.8mmol)を追加し、水浴中1時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、セライト濾過し抽出、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/3)で精製し、目的物(収率68%)を得た。

>99.9%ee CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 5.7分

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.30(s, 3H), 1.64(s, 3H), 2.56(s, 3H), 2.66(s, 3H), 3.59(d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.14(d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 7.29(s, 1H), 8.04(s, 1H) MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 256[M+1]  $^{+}$ 

[0603]

 $(3R^*,4S^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-7x-1)T+1)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(3R\*,4S\*)-3,4-エポキシ-2,2,7,9-テトラメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(0.80g,3.14mmol)の1,4-ジオキサン溶液(1.6mL)に、室温で過塩素酸リチウム(334mg,3.14mmol)、フェニルエチルアミン(0.473mL,3.77mmol)を加え、70℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製し、溶媒を留去後、酢酸エチル(2mL)を加え、マレイン酸(376mg,3.23mmol)の酢酸エチル溶液(8mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで目的物(収率86%)を得た。

白色結晶

mp.;215-219℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$   $\delta$  ; 1.16(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.93-3.39 (m, 4H), 4.07(dd, J = 6.4 Hz, 9.4Hz, 1H), 4.64(d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.27(d, J = 5.8Hz, 1H), 7.24-7.26(m, 4H), 7.30(s, 1H), 7.33(s, 1H), 7.36(s, 1H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 377[M+1]^{+}$ 

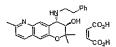
MS(ESI-)m/z; 421 [M+45] +

[0604]

合成例13

(3R\*, 4S\*)-2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

【0605】 【化62】



[0606]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0607]

(3R\*, 4R\*)-3,4-エポキシ-2,2,7-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

【0608】 【化63】



[0609]

99.3%ee CHIRALPAK AD-RH20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40保持時間 6.2分

 $^{1}$ H-NMR(CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ ; 1.28(s, 3H), 1.64(s, 3H), 2.71(s, 3H), 3.59(d, J = 4.4 Hz, 1H),

4.15(d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.13(s, 1H), 7.23(d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.91(d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.05(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 242[M+1]^{+}$ 

[0610]

 $(3R^*, 4S^*)$ -2, 2, 7-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アラノ[(2-フェニルエチル)アミノ[(2-フェニルエチル)アラノ[(2-フェニルエチル)アラノ[(2-フェニルエチル)アラノ[(2-フェニルエチル)アラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ピラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ビラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ビラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ビラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ビラノ[(2-フェニルエチル)アー2H-ビラノ[(2-フェニルエー2H-ビラノ[(2-フェニル]-(2-フェニルエー2H-ビラノ[(2-フェニルエー2H-ビラノ[(2-フェニル-2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニル-2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニル-2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニル-2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニル-2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニー2H-ビラノ[(2-D-エニ

白色結晶

mp.; 214-217℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$   $\delta$ ; 1.15(s, 3H), 1.48(s, 3H), 2.62(s, 3H), 2.93-3.14 (m, 4H), 4.0 3-4.07(m, 1H), 4.61(br s, 1H), 6.04(s, 2H), 6.23(br s, 1H), 7.23-7.39(m, 7H), 8.0 9(d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 363[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 407 [M+45] +

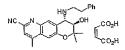
[0611]

合成例14

 $(3R^*,4R^*)$ -3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

[0612]

【化64】



[0613]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0614]

 $(3R^*, 4R^*)$  $_{-3}$ , 4 $_{-}$  エポキシ $_{-3}$ -ヒドロキシ $_{-2}$ , 2, 9-トリメチル $_{-3}$ , 4-ジヒドロ $_{-2H}$ -ピラノ $_{-2H}$ -ピラノ $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-3}$   $_{-2}$   $_{-3}$   $_$ 

[0615]

【化65】



[0616]

(収率33%)

99.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3 保持時間18.6分

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.33(s, 3H), 1.66(s, 3H),2.65(s, 3H), 3.64(d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.17(d, J = 4.4 Hz, 1H),7.33(s, 1H), 7.47(s, 1H), 8.18(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 267[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 265 [M-1] +

[0617]

 $(3R^*,4S^*)$ -3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル 1マレイン酸塩

(収率23%) 淡褐色結晶

 $^{1}$ H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ ; 1.20(s, 3H), 1.52(s, 3H), 2.66(s, 3H), 2.98-3.33(m, 4H), 4.09 (m, 1H), 4.71(br s, 1H), 6.09(s, 2H), 6.33(br s, 1H), 7.23-7.34(m, 5H), 7.51(s, 1H), 7.86(s, 1H), 8.51(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 388[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 432 [M+45] +

[0618]

合成例15

(3R\*, 4S\*)-3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒド ロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボキサミド

[0619]【化66】

[0620]

合成例11と同様の方法により (3R\*,4S\*)-3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フ ェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリルから 合成した(収率9%)。

白色結晶

mp.; 168-169℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.26(s, 3H), 1.57(s, 3H), 1.83(br s, 3H), 2.65(s, 2H), 2.90-3.1 6(m, 4H), 3.66(d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.95(d, J = 10.5 Hz, 1H), 5.61(br s, 1H), 7.24-7.36(m, 5H), 7.85(s, 1H), 8.00(br s, 1H), 8.04(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z; 406[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 450 [M+45] +

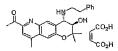
[0621]

合成例 1 6

(3R\*,4S\*)-|3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒド ロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル}エタノン 1マレイン酸塩

[0622]

【化67】



[0623]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0624]

(3R\*, 4S\*)- {3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒド ロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル}エタノン

[0625]【化68】

[0626]

(3R\*, 4S\*)-3-ヒドロキシ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒ ドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-カルボニトリル(120mg, 0.309mmo1)のベンゼン(1.6mL )-ジエチルエーテル(1.4mL)溶液に、氷浴中、3.0M臭化メチルマグネシウムジエチルエー テル溶液(0.30mL)を滴下し、氷浴中2時間撹拌した。氷浴中、3.0Mメチルマグネシウムブ ロマイドジエチルエーテル溶液(0.50mL)を滴下し、さらに30分撹拌した。反応終了後、塩 化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾 燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィーで精製し、目的物(収率25%)を得た。  $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.19(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.53(d, J = 0.83 Hz, 3H), 2.76(s, 3H) , 2.77-3.06 (m, 5H), 3.55 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.81 (dd, J = 1.4 Hz, 10.5 Hz, 1H),  $7.15-7.29 \, (m, 6H), 7.78 \, (s, 1H), 7.85 \, (d, J = 1.4 \, Hz, 1H)$  $MS(ESI^{+})m/z; 405[M+1]^{+}$ 

[0627]

 $(3R^*,4S^*)$ - $\{3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル エタノン <math>1$ マレイン酸塩

(3R\*,4S\*)- ${3-ヒドロキシ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル}エタノン(31.3mg,0.077mmo1)の酢酸エチル溶液(2mL)にマレイン酸(10.0mg,0.086mmo1)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで、目的物(収率80%)を得た。$ 

白色結晶

mp.;230-234℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$   $\delta$ ; 1.18(s, 3H), 1.51(s, 3H), 2.66(s, 3H), 2.74(s, 3H), 2.98-3.34(m, 4H), 4.10(m, 1H), 4.66(br s, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29(br s, 1H), 7.25-7.36(m, 5H), 7.48(s, 1H), 7.87(s, 1H), 8.56(s, 1H)

[0628]

合成例17

 $(1R^*, 2R^*)$ -3, 3-ジメチル-1-[(2-フェニルエチル) アミノ]-2, 3-ジヒドロ-1H-ピラノ[3, 2-f]1キノリン-2-オール

【0629】 【化69】



[0630]

合成例12の方法を準拠して合成した。

(収率2段階4%)

白色結晶

mp.; 170-171℃

 $\begin{array}{l} ^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3}) \quad \delta \; ; \; 1.31 (\text{s}, \; 3\text{H}), \; 1.45 (\text{s}, \; 3\text{H}), 1.61 (\text{br s}, \; 6\text{H}), \; 2.71-2.84 (\text{m}, \; 3\text{H}), \; 2.9 \\ 1-2.97 (\text{m}, \; 1\text{H}), \; 3.83 (\text{d}, \; \text{J} = 5.5 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 4.11 (\text{d}, \; \text{J} = 5.5 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 7.12 (\text{d}, \; \text{J} = 7.98 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 7.18-7.25 (\text{m}, \; 5\text{H}), \; 7.90 (\text{d}, \; \text{J} = 9.1 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 8.15 (\text{d}, \; \text{J} = 8.5 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}), \; 8.73 (\text{dd}, \; \text{J} = 1.4 \; \text{Hz}, \; 4.1 \; \text{Hz}, \; 1\text{H}) \\ \end{array}$ 

 $MS(ESI^{+})m/z; 349[M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 393 [M+45]

エポキシ体 97.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3保持時間7.0分

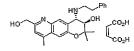
[0631]

合成例18

 $(3R^*,4S^*)$ -7-ヒドロキシメチル-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0632]

【化70】



[0633]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0634]

(2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル)-メチルアセテート

[0635]

【化71】



[0636]

2,2,7,9-テトラメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(3.0g,12.5mmol)のクロロホルム溶液(30.0mL)に、室温でm-クロロ過安息香酸(4.76g,27.6mmol)のクロロホルム(12mL)-メタノール(3mL)溶液を滴下し、室温で30分攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、室温で残渣に無水酢酸(12mL)を加え、150Cで1時間攪拌した。反応終了後、無水酢酸を留去し、炭酸ナトリウム水溶液で中和し、クロロホルムで抽出、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、目的物(収率64%)を得た。

#### 黑色油状物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$  &; 1.50(s, 6H), 2.17(s, 3H), 2.61(s, 3H), 5.30(s, 2H), 5.90(d, J = 9.91 Hz, 1H), 6.57(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.19(s, 1H), 7.24(s, 1H), 7.70(s, 1H) MS(ESI+)m/z; 298[M+1] +

#### [0637]

 $(3R^*, 4R^*)$  $_-(3, 4$  $_-$ エポキシ $_-2, 2, 9$  $_-$ トリメチル $_-3, 4$  $_-$ ジヒドロ $_-2H$  $_-$ ピラノ[2, 3 $_-g]$ キノリン $_-7$  $_-$ イル) $_-$ メチルアセテート

[0638]

【化72】

[0639]

(収率77%)

>99.9%ee CHIRALPAK AD-RH20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40保持時間 5.4分

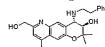
 $MS(ESI^{+})m/z;314 [M+1]^{+}$ 

# [0640]

(3R\*, 4S\*)-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4- $[(2-7x-2)^2-3, 4-3]$ ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

[0641]

【化73】



#### [0642]

 $(3R^*,4R^*)$ -(3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-7-イル)-メチルアセテート(403mg,1.29mmo1)の1,4-ジオキサン溶液(1mL)に、室温で過塩素酸リチウム(137mg,1.29mmo1)、フェニルエチルアミン(0.195mL,1.55mmo1)を加え、70 で で 1.5 時間 攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(へキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(収率32%)を得た。

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$  ; 1.24(s, 3H), 1.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.87–3.08(m, 5H), 3.63(d , J = 10.2 Hz, 1H), 3.81(d, J= 10.5 Hz, 1H), 4.82(s, 2H), 7.02(s, 1H), 7.23–7.36 (m, 6H), 7.75(s, 1H) MS(ESI^+)m/z;393 [M+1]  $^{+}$ 

MS(ESI-)m/z; 437 [M+45] +

#### [0643]

 $(3R^*, 4S^*)$ -7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(3R\*, 4S\*)-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4

-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール(157mg,0.407mmol)の酢酸エチル溶液(4mL)に、マレイン酸(52mg,0.448mmol)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで目的物(収率80%)を得た。

淡黄色結晶

mp.; 216-221℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$  &; 1.17(s, 3H),1.50(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.98-3.40(m, 4H), 4.06 -4.11(m, 1H), 3.81(d, J= 10.5 Hz, 1H), 4.66-4.69(3H), 5.50(br s, 1H), 6.06(s, 2H), 6.30(br s, 1H),7.23-7.35(m, 5H), 7.40(s, 1H), 7.47(s, 1H), 8.35(s, 1H)

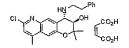
[0644]

合成例 19

(3R\*, 4S\*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0645]

【化74】



[0646]

合成例12の方法を準拠して合成した。

[0647]

 $(3R^*, 4R^*)$ -7-クロロ-3, 4-エポキシ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン

[0648]

【化75】



[0649]

(収率78%)

99.1%eeCHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3保持時間18.9分

黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.28(s, 3H), 1.65(s, 3H), 2.59(d, J = 0.8 Hz, 3H), 3.60(d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.13(d, J= 4.4 Hz, 1H), 7.19(s, 1H), 7.29(d, 1H), 8.02(s, 1H) MS(ESI<sup>+</sup>)m/z; 276[M+1]  $^{+}$ 

[0650]

 $(3R^*,4S^*)$ -7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(2段階 収率34%)

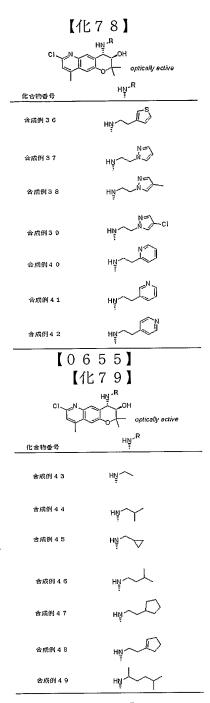
[0651]

合成例20-49

合成例20から合成例49は合成例19と同様の方法で合成した。

[0652]

【化76】	
CI N HÑ- <sub>K</sub>	
\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	optically active
化合物番号	HŅ
合成例20	HÍ
含成例21	HIN
含成例22	нй
合成例 2 3	HŅ
合成例24	HN F
合成例25	HŅ
含成例26	HŅ NH₂
合成例27	нй он
合成例28	нұ
舎成例29	HN CO



[0656]

合成例20

(収率81 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.60 (br s, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.1 2 (s, 1H), 3.72 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.85-4.00 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 6H), 8.08 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;383 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;427[M+45]^{+}$ 

[0657]

合成例 2 1

(3R\*, 4S\*) - 7 - 2 - 4 - [2 - (1, 3 - ベンゾジオキソールー 5 - 4 ル) メチル] アミノ<math> -2, 2, 9 - 1 リメチルー 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール

(収率 92%)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),2.59 (s, 3H), 3.70 (d, J = 10.3 Hz , 1H), 3.82 (Abq, J = 12.8 Hz, 2H), 3.97 (dd, J = 10.3, 1.2 Hz, 1H), 5.96 (s, 2H) , 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 1.6 Hz, 1 H), 7.13 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 8.04 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;427 [M+1]^{+}$ 

[0658]

合成例 2 2

(3R\*, 4S\*) - 7クロロー 2, 2, 9 ートリメチルー4ー[(3-7x=2) ロピル)アミノ] - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 ーオール

(収率72%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$  : 1.28 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.80-1.95 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.65-2.85 (m, 5H), 3.24 (s, 1H), 3.61 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.10-7.20 (m, 3H), 7.25-7.35 (m, 3H), 7.94 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;411 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;455 [M+45]^{+}$ 

[0659]

合成例 2 3

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - フルオロフェニル) エチル] アミノ \} - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 96%)$ 

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$  : 1.25 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.57 (br s, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.8 0 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 3H), 3.58 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H),6.95-7.05 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.26 (s, 1H), 7.89 (s, 1H). MS (ESI^+) m / z;415 [M+1]^+

[0660]

合成例 2 4

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2-(2-フルオロフェニル)エチル]アミノ\} - 2, 2, 9$  - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 79 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl3)  $\delta$  : 1.25 (s, 3H), 1.54 (s, 3H),1.61 (br s, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.8 6 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.95–3.10 (m, 3H), 3.56 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 10.4 Hz, 1H),7.00–7.25 (m, 6H), 7.90 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;415 [M+1]^{+}$ 

[0661]

合成例 2 5

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - クロロフェニル) エチル] アミノ - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール (収率 78 %)$ 

無色無定形物

[0662]

合成例 2 6

 $(3R*, 4S*)-4-\{[2-(4-r \in J) + J) + J\} - 7-2 + DD - 2, 2, 9-1$ 

特願2004-084605 トリメチルー3, 4ージヒドロー2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール (収率 40 %) 無色無定形物  $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.23 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.58 (br s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.7 1 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.85-3.05 (m, 2H), 3.11 (br s, 1H), 3.57 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 6.65 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.5 Hz, 2H) ),7.11 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.81 (s, 1H).  $MS (ESI^{+}) m / z;412 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;456 [M+45]^{+}$ [0663] 合成例 2 7 9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリンー3-オール (収率72%) 無色無定形物  $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.27 (s, 1.5H), 1.28 (s,1.5H), 1.56 (s, 3H), 1.77 (br s, 2H), 2.57 (s, 3H), 2.85-3.15 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.75 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.75-4.85 (m, 1H), 7.25(s, 1H), 7.27-7.40 (s, 6H), 7.99 (s, 0.5H), 8.00 (s , 0.5H).  $MS (ESI^{+}) m / z;413[M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;457[M+45]^{+}$ [0664]合成例 2 8 (3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - (2 - フェニルブチル) アミノー2,2,9 - トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g]キノリンー3-オール (収率 50%) 淡褐色無定形物  $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.86 (t, J = 7.3 Hz,3H), 1.20 (s, 3H), 1.53 (s, 3H), 1.51-1.7  $1 \text{ (m, 2H), } 2.57 \text{ (s, 3H), } 2.57-2.64 \text{ (m, 1H), } 2.86 \text{ (dd, } J = 11.6, 9.1 Hz, 1H), } 2.86$ (dd, J = 11.6, 5.2 Hz, 1H), 3.55 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 10.2 Hz, 1H) , 7.15(s, 1H), 7.20-7.32 (m, 4H), 7.38 (dd, J = 7.1, 7.1 Hz, 2H), 7.74 (s, 1H) MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;425 [M+1]<sup>+</sup> [0665]合成例 2 9  $(3R*, 4S*) - 7 - クロロ-4 - \{[2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル$ ) エチル] アミノ $\}-2,2,9-$ トリメチルー3,4-ジヒドロー2H-ピラノ [2,3g] キノリン-3-オール (収率 62%) 淡褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$  : 1.26 (s, 3H), 1.56 (s, 3H),1.66 (br, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.74 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.89-3.00 (m, 2H), 3.1 (br, 1H), 3.60 (d, J = 10.4 Hz, 1H),3.86 (d, J = 10.4Hz, 1H), 5.95 (Abq, 2H), 6.66-6.77 (m, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.26(s, 1H), 7.83(s, 1H)

MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;441 [M+1]<sup>+</sup>

[0666]

合成例30

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - {[2 - (1 - ピペリジニル)エチル$ ]アミノ $\}-3$ , 4-ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリンー 3-オール (収率61%)

淡黄色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.60 (br s, 2H), 1.50-1.70 (m, 6H) 2.30-2.60 (m, 6H), 2.58 (s, 3H), 3.06 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 3.54 (d, J = 10.4 Hz , 1H), 3.80 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 8.06 (s, 1H).  $MS (ESI^{+}) m / z;404 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0667]合成例31 (2, 3-g) ニル)エチル]アミノ(3, 4-i)ビドロー2H-ピラノ [2, 3-g] キノリンー3ーオ ール (収率55%) 無色無定形物  $^{1}$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.49-2.00 (m, 8H), 2.10-2.25 (m, 2 H), 2.34 (s, 1.5H), 2.35 (s, 1.5H), 2.58 (s,3H), 2.65-2.85 (m, 2H), 3.00-3.15 (m , 1H), 3.62 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 3.70 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 3.85 (d, J = 10.44 Hz, 0.5H, 3.88(d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.96 (s, 1H)). MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;404  $[M+1]^+$  $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0668]合成例32  $(3R^*, 4S^*)-4-[(2-ry-1)x+w)r=1]-7-0pp-2,2,9-hy++w$ (収率78%) 淡黄色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.27 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.77 (br s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.9 5-3.10 (m, 2H), 3.30 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz), 3.93 (d, J = 10.2 Hz) 10.2 Hz, 1H), 6.65-6.80 (m, 3H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.28 (s, 1H), 7.98 (s, 1H). MS (ESI<sup>+</sup>) m / z:412  $[M+1]^+$  $MS (ESI^{-}) m / z;456 [M+45]^{+}$ [0669] 合成例 3 3  $(3R^*, 4S^*) - 7 - 9 - 9 - 4 - ([2-[x+y(3-x+y)z=y)]x=y]x=y$ ノ) -2, 2, 9 - トリメチルー 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3-g] キノリンー 3ーオール (収率90%) 淡黄色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.23 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.62 (br s, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.80-3.00 (m, 2H), 3.30-3.50 (m, 5H), 3.61 ( d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.91(d, J = 10.1 Hz, 1H), 6.60-6.70 (m, 4H), 7.05-7.15 (m, 2H), 7.96 (s,1H).  $MS (ESI^{+}) m / z;454 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;498 [M+45]^{+}$ [0670] 合成例34  $(3R^*, 4S^*) - 7 - 9 \Box \Box - 2, 2, 9 - \gamma \cup 3 + \gamma \cup 4 - \gamma \cup (1 - \gamma + \gamma \cup (R) - 2 - \beta \cup$ ロリジニル)メチル]アミノ-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリンー

3 ーオール (収率 93%) 淡黄色無定形物

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.27 (s, 1H), 1.32 (t, J= 7.1 Hz, 2H), 1.56 (s, 3H), 1.95-2.1 2 (br, 4H), 2.56 (s, 3H), 2.71-2.81 (br, 2H), 2.98-3.37 (m, 4H), 3.64-4.01 (m, 5H) , 7.12 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 8.01 (s, 1H)  $MS (ESI^{+}) m / z;405 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;448 [M+45]^{+}$ [0671]合成例35 T = [2, 3 - g] キノリン-3-オール マレイ ン酸塩 (88%収率) 白色固体  $^{1}$ H-NMR (CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$ : 1.23-1.30 (m, 9H), 1.57 (s,3H), 2.64 (s, 3H), 3.50-3.85 (m, 4) H), 4.02 (d, J = 10.2 Hz, IH), 6.27(s, IH), 7.37 (s, IH), 7.49 (s, IH), 8.13 (s, 1H) [0672]フリー体  $(3R^*, 4S^*) - 7 - 2 - 2 - 2 - 2 - 9 - 1 - 1 - 4 - [(2, 2 - 3 - 1 + 2 - 2 - 2)]$ 淡黄色無定形物  $MS (ESI^{+}) m / z;410 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;453 [M+45]^{+}$ [0673] 合成例36  $(3R^*, 4S^*) - 7 - 2 - 2 - 2 - 2 - 9 - 1 - 1 - 4 - [2 - (3 - 7 - 2 - 1) - 2 - 2]$ r = 1 - 3, 4 - i = 1 - 2 + 1 - 2(収率 57%) 淡黄色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.24 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.56 (s, 3H), 2.84 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.90-3.09 (m, 2H), 3.60 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 6.94-7.01 (m, 2H), 7.13 (s,1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 7.89 (s, 1H)  $MS (ESI^{+}) m / z;404 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;447 [M+45]^{+}$ [0674]合成例37 , 9 - トリメチル- 3 , 4 - ジヒドロ- 2 H - ピラノ「2, 3- g ] キノリン- 3 - オール (収率 59%) 淡黄色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.86 (br), 2.57 (s, 3H), 3.26-3.31 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 4.24-4.32 (m, 2H), 5.0 (br), 6.32 (dd, J = 1.7, 1.7 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.45 (d, J = 1.7 Hz, 1H, 7.58 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H)  $MS (ESI^{+}) m / z;387 [M+1]^{+}$ [0675] 合成例38 [x] アミノ[x] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キ ノリンー3ーオール

(収率 70%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$  : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),2.0 (br), 2.10 (s, 3H), 2.57 (s, 3 H), 3.16–3.31 (m, 2H), 3.64 (d, J =10.2 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.11 –4.30 (m, 2H), 5.2 (br),7.13 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.98 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;401 [M+1]^{+}$ 

[0676]

合成例39

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロー4 - \{[2 - (4 - クロロピラゾールー1 - イル) エチル] アミノ<math>\} - 2, 2, 9 -$ トリメチル- 3, 4 -ジヒドロ- 2H -ピラノ [2, 3 - g] キノリン- 3 -オール

(収率 89%)

淡黄色無定形物

<sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.84 (br), 2.58 (s, 3H), 3.26-3.29 (m, 2H), 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H),3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 4.16-4.29 (m, 2H), 4.51 (br, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.97 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;421 [M+1]^{+}$ 

[0677]

合成例40

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (2 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 83%)

黄色無定形物

 $^{1}$  H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$  : 1.32 (s, 3H), 1.61 (s, 3H),1.82 (br), 2.57 (s, 3H), 2.92-3.12 (m, 2H), 3.26-3.30 (m, 2H), 3.74 (d, J= 10.2 Hz, 1H), 3.92 (d, J= 10.2 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.17-7.27 (m, 3H), 7.64-7.70 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.56 (d, J= 5.0 Hz, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}$ 

[0678]

合成例 4 1

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (3 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール (収率 61%)

褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl3)  $\delta$  : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.73 (br), 2.58 (s, 3H), 2.80–2.85 (m, 2H), 2.92–3.07 (m, 2H), 3.23 (br), 3.61(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H),7.22–7.27 (m, 2H), 7.55 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.47–8.48 (m, 2H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}$ 

[0679]

合成例 4 2

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (4 - ピリジルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール (収率 47%)

淡褐色無定形物

<sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H),1.89 (br), 2.58 (s, 3H), 2.80-2.85 (m, 2H), 2.94-3.11 (m, 2H), 3.6 (br), 3.63(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (d, J= 5.7 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.47 (d, J=5.7 Hz, 2H)

```
MS (ESI^{+}) m / z;398 [M+1]^{+}
```

#### [0680]

合成例 4 3

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー4 - エチルアミノー 2, 2, 9 - トリメチルー 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール

(収率 95%)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.18 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.68-2.91 (m, 2H), 3.63 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 3.87 (dd, J=10.4, 1.2 Hz, 1H), 7.15 (d, J= 1.1Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (d, J= 1.1 Hz, 1H). MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;321 [M+1]<sup>+</sup>

[0681]

合成例44

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - イソブチルアミノー2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール

(収率 96 %)

淡褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.94-0.98 (m, 6H), 1.29 (s,3H), 1.58 (s, 3H), 1.68-1.76 (m, 1 H), 2.50-2.62 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 3.36 (br, 1H), 3.63 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.88 (dd, J = 10.2, 1.1 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.93 (s, 1H) MS (ESI^+) m / z;239 [M+1]^+

[0682]

合成例 4 5

(3R\*, 4S\*) -7-クロロ-4- [(シクロプロピルメチル)アミノ] -2,2,9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール (収率 85 %)

淡褐色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.13-0.20 (m, 2H), 0.48-0.54 (m, 2H), 0.95-1.01 (m, 1H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.8 (br, 1H), 2.53 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.70 (m, 1H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.91 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.90 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;347 [M+1]^{+}$ 

[0683]

合成例 4 6

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー4 - イソアミルアミノー2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール

(収率 64 %)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$ : 0.90 (d, 6H), 1.29 (s, 3H),1.39–1.46 (m, 2H), 1.58 (s, 3H), 1.62–1.74 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.64–2.85 (m, 2H), 3.64 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.8 7 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15(s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.93 (s, 1H) MS (ESI^+) m / z;363 [M+1]^+

[0684]

合成例47

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (シクロペンチルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール (収率 78%)

淡黄色固体

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.08-1.11 (m, 2H), 1.29 (s,3H), 1.49-1.62 (m, 6H), 1.54 (s, 3 H), 1.71-1.83 (m, 3H), 2.58 (s, 3H), 2.67-2.82 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H)

, 3.86 (d, J = 10.4Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (s, 1H)  $MS (ESI^{+}) m / z;389 [M+1]^{+}$ 

[0685]

合成例 4 8

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [2 - (1 - シクロペンテニルエチル) アミノ]-2,2,9ートリメチルー3, 4ージヒドロー2 Hーピラノ [2,3-g] キノリンー3ー オール

(収率 70 %)

淡褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1 $_{3}$ )  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 1.86-1.94(m, 2H), 2.22-2.34 (m, 7) H), 2.58 (s, 3H), 2.79-2.96 (m, 2H), 3.63 (d, J=10.5 Hz, 1H), 3.87 (dd, J=10.55, 1.2 Hz, 1H), 5.44 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.92 (s, 1H)  $MS (ESI^{+}) m / z;387 [M+1]^{+}$ 

[0686]

合成例 4 9

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-2, 2, 9 - トリメチル-4 - [(1, 4-ジメチルペンチル)]アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ [2,3-g] キノリン-3-オール (収率 83%)

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.91 (dd, J = 6.6 Hz, 9.6Hz, 6H), 1.13-1.34 (m, 9H), 1.56 (s, 6)  $\rm H)$ , 2.57 (s, 3H), 3.22-3.44 (m, 2H), 3.80-3.85 (br, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.26 (s, 1H) H), 7.96-7.98 (br, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;392 [M+2]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;435 [M+45]^{+}$ 

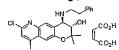
[0687]

合成例 5 0

(3S\*, 4R\*)-7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0688]

【化80】



[0689]

合成例50はPh,Phサレンマンガン錯体(XX)の反対のエナンチオマー(以下、ent-Ph .Phサレンマンガン錯体と記載)を用い合成した。

[0690]

(3S\*,4S\*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キ ノリン

[0691]

【化81】



[0692]

7-クロロ-2,2,9-トリメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(200mg,0.77mmol)の酢酸エチル 溶液(3.0mL)に、室温でN-メチルイミダゾール(0.012mL, 0.154mmol)、ent-Ph,Phサレンマ ンガン錯体(8.0mg, 0.0077mmol)を加え、水浴中、次亜塩素酸ナトリウム水溶液(1.0g, 1 .513mol/kg, 1.54mmol)を滴下し、水浴中40分攪拌した。水浴中、次亜塩素酸ナトリウム 水溶液(1.0g, 1.513mol/kg, 1.54mmol)を滴下し、水浴中、さらに30分攪拌した。反応終 了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、セライト濾過し抽出、有機層を炭酸水 素ナトリウム水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=10/1)で精製し、(3S\*,4S\*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン(収率94%)を得た。(>99.9%ee CHIRALCEL OJ-R アセトニトリル/メタノール/0.01M塩化ナトリウム水溶液=1/3/3 保持時間44.3分)

[0693]

(3S\*,4R\*)-7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H -ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

(3S\*, 4S\*) -7-クロロ-3, 4-エポキシ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g] キノリン(199mg, 0. 72mmol) の1, 4-ジオキサン溶液(0. 4mL)に、室温で過塩素酸リチウム(7. 0mg, 0. 72mmol)、フェネチルアミン(0. 11mL, 0. 87mmol)を加え、70℃で3時間攪拌した。反応終了後、反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、中圧カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、溶媒を留去後、酢酸エチル(2mL)を加え、マレイン酸(50.3 mg, 0. 43mmol)の酢酸エチル溶液(2mL)を滴下し、析出した固体を濾過することで(3S\*, 4R\*)-7-クロロ=2, 2, 9-トリメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]=3, 4-ジヒドロ=2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン=3-オール 1マレイン酸塩(収率41%)を得た。

白色結晶

mp.;240-242℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ : 1.18(s, 3H),1.50(s, 3H), 2.60(s, 3H), 2.97-3.32(m, 4H), 4.04-4.09(m, 1H), 4.65(d, J= 9.6 Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.29(br s, 1H), 7.23-7.35(m, 5H), 7.44(s, 2H),8.32(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z;397 [M+1]^{+}$ 

MS(ESI-)m/z;441 [M+45] +

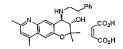
[0694]

合成例 5 1

 $(3S^*, 4R^*)$ -2,2,7,9-テトラメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 1マレイン酸塩

[0695]

【化82】



[0696]

合成例51は合成例50と同様の方法により合成した。

(2段階収率25%)

エポキシ99.1%ee CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 10.3分

白色結晶

mp.;215-216℃(分解)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d6); 1.16(s, 3H), 1.49(s, 3H), 2.55(s, 3H), 2.58(s, 3H), 2.97-3.32 (m, 4H), 4.02-4.04(m, 1H), 4.62(br s, 1H), 6.04(s, 2H), 6.25(br s, 1H), 7.24-7.36(m, 7H), 8.31(s, 1H)

 $MS(ESI^{+})m/z;377 [M+1]^{+}$ 

[0697]

合成例 5 2

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - (ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール 塩酸塩

[0698]

【化83】

[0699]

 $(3R^*, 4S^*)$ -4-アミノ-7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール

[0700]

【化84】



[0701]

(3R\*,4R\*)-7-クロロ-3,4-エポキシ-2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g] キノリン(2.0g,7.25mmo1)のエタノール溶液(20mL)にアンモニア水(10mL)を加え、封管中、90℃で3時間加熱攪拌した。反応終了後、濃縮し、酢酸エチルを加え、水、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し、目的物(86%収率)を得た。

白色固体

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDC1}_{3})$   $\delta$ ; 1.30 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),1.67 (br s, 2H), 2.59 (s, 3H), 3.28 (br s, 1H), 3.45 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.85(d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 8.02 (s, 1H).

[0702]

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - (ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール

[0703]

【化85】



[0704]

(3R\*, 4S\*) -4-アミノ-7-クロロー2, 2, 9-トリメチルー3, 4-ジヒドロー2H-ピラノ[2, 3-g] キノリンー3ーオール(60 mg, 0.205mmo1)のメタノール溶液(1.2 mL)にブチルアルデヒド(35mg, 0.0.41 mmo1)を加え、室温で20分攪拌した。ナトリウムシアノボロヒドリド(52mg, 0.82 mmo1)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物(収率41%)を得た。

無色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.90 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.29 (s, 3H), 1.20-1.45 (m, 4H), 1.5 5-1.70 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 2.60-2.82 (m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.93 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;363 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;407 [M+45]^{+}$ 

[0705]

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-2, 2, 9 - トリメチル-4 - (ペンチルアミノ) - 3, 4 - ジヒドロ-2H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3 - オール 塩酸塩

(3R\*, 4S\*) -7-クロロ-2, 2, 9-トリメチル-4-(ペンチルアミノ) -3, 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3-g] キノリン-3-オール (28mg, 0.77 mmol)のエーテル溶液(560  $\mu$  L)に0℃で、4M-塩化水素エーテル溶液(56  $\mu$  L)を滴下し、0℃

で15分攪拌した. 固形物を濾取し、エーテルで洗浄、乾燥し、目的物(収率 88 %)を得た

# 無色結晶

mp.: 291-294℃ (分解)

[0706]

合成例 5 3 - 5 7

合成例53から合成例57の化合物は合成例52の方法に従い合成した。

[0707]

【化86】

化合物番号	н <sub>ұ</sub> - <sup>R</sup>
合成例53	нй нсі
含成例5 4	ны нсі
合成例5 5	нй
合成例5 6	HN CI
合成例 5 7	HŅ

# [0708]

## 合成例 5 3

 $(3R^*, 4S^*) - 7 - クロロ-4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール 塩酸塩$ 

# フリー体

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ-4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル-3, 4 - ジヒドロ-2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン-3 - オール (収率 31 %)

## 無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl3)  $\delta$  : 0.90–1.00 (m, 2H), 1.05–1.25(m, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.58 (s, 3 H) 1.60–1.70 (m, 7H), 2.58 (s, 3H), 2.75–2.85(m, 2H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.93 (s, 1H)

# [0709]

# 塩酸塩

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー4 - [(2-シクロヘキシルエチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー3 - オール 塩酸塩

(収率76%)

## 無色結晶

mp.:294-295℃ (分解)

 $MS (ESI^{+}) m / z;403 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;447 [M+45]^{+}$ 

# [0710]

#### 合成例 5 4

フリー体

(3R\*, 4S\*) -7-クロロ-2,2,9-トリメチル-4-[(2-テトラヒドロ-2 H-ピラン-4-イルエチル) アミノ] -3 , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3- g] キノリン-3-オール

(収率 65%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.29 (s, 3H), 1.20-1.40 (m,4H), 1.58 (s, 3H), 1.50-1.80 (m, 4) H), 2.59 (s, 3H), 2.65-2.90 (s, 2H), 3.20-3.40 (m, 3H), 3.64 (d, J=10.4 Hz, 1H) , 3.70-3.75 (m, 1H), 3.85(d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.80-4.00 (m, 3H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.92 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;405 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;449 [M+45]^{+}$ 

[0711]

塩酸塩

H-ピラン-4-イルエチル) アミノ] -3 , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2, 3- g] キノリン-3-オール塩酸塩

(収率 72%)

無色結晶

mp.: 318-320℃ (分解)

[0712]

合成例 5 5

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー2, 2, 9 - トリメチルー4 - [(2ーテトラヒドロー2)]H- チオピラン-4-イルエチル) アミノ] -3 , 4-ジヒドロ-2 H-ピラノ [2 , 3g] キノリン-3-オール

(収率 63 %)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.28 (s, 3H), 1.40-1.60 (m,5H), 1.56 (s, 1H), 1.90-2.00 (m, 2) H), 2.59 (s, 3H), 2.50-2.85 (m, 6H), 3.23 (s, 1H), 3.63 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.16(s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.91 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;421 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;465 [M+45]^{+}$ 

[0713]

合成例 5 6

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ4 - ( + [6 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピリジニル] メキノリンー3ーオール 塩酸塩

フリー体

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロ4 - ( + [6 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ピリジニル] メキノリンー3ーオール

(収率 16%)

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.30 (s, 3H), 1.59 (s, 3H),1.60 (br s, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.9 8 (s, 1H), 3.75-4.10 (m, 4H), 7.19 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.45 (d, J=8.8 Hz, 2H)), 7.71 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.80 (dd, J = 9.0, 2.2Hz, 1H), 7.96 (d, J = 8.8 Hz, 2) H), 8.09 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.2 Hz, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;494[M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;538 [M+45]^{+}$ 

[0714]

塩酸塩

 $(3R*, 4S*) - 7 - クロロ4 - ({[6-(4-クロロフェニル)-3-ピリジニル]メチル}アミノ) - 2,2,9-トリメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン-3-オール 塩酸塩$ 

(収率 67 %)

淡黄色固形物

[0715]

合成例 5 7

(3R\*, 4S\*) - 4 - [(2 - ベンゾフラニルメチル) アミノ] - 7 - クロロー 2, 2, 9 - トリメチルー3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリンー 3 - オール (収率 74%)

無色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl3)  $\delta$  : 1.28 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),2.0 (br), 2.59 (s, 3H), 3.35 (br, 1H), 3.75 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.04 (dd, J = 10.2, 1.1 Hz, 1H), 4.06 (s, 2H), 6. 60 (s, 1H), 7.16 (s, 1H),7.18-7.27 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 1 H), 7.49-7.52 (m, 1H), 8.08 (d, J = 1.1 Hz, 1H)

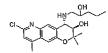
 $MS (ESI^{+}) m / z;423 [M+1]^{+}$ 

[0716]

合成例 5 8

(3R\*, 4S\*) - 7 - クロロー4 - [(2-ヒドロキシペンチル) アミノ] - 2, 2, 9 - トリメチル - 3, 4 - ジヒドロー 2 H - ピラノ [2, 3 - g] キノリン - 3 - オール

【0717】 【化87】



[0718]

窒素気流下、(3R\*,4S\*) -4-アミノー 7-クロロー2、2、9-トリメチルー3、4-ジヒドロー2Hーピラノ [2,3-g] キノリンー3-オール(100 mg、0.343mmol) と過塩素酸リチウム(36 mg、0.343 mmol)のジオキサン溶液(0.50mL)に室温で 1,2-エポキシペンタン(71  $\mu$ L、0.682 mmol)を加え、70Cで 2 5 時間攪拌した。反応終了後、酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(収率59%)を得た。

淡黄色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.93 (t, J = 6.9 Hz,3H), 1.28 (s, 3H), 1.30-1.50 (m, 4H), 1.5 7 (s, 3H), 1.91 (br s, 3H), 2.59 (s,3H), 2.60-2.70 (m, 1H), 2.85-3.00 (m, 1H), 3.60-3.75 (m, 2H), 3.90-4.00 (m,1H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.99 (s, 0.5H), 8.00 (s, 0.5H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;379 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;423 [M+45]^{+}$ 

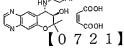
[0719]

合成例 5 9

(8R\*, 9S\*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 1マレイン酸塩

[0720]

【化88】



出証特2005-3008820

ルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール

【0722】 【化89】

H<sub>2</sub>N Ph

[0723]

1気圧の水素気流下、(3R\*, 4S\*)-6-アミノ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-7 ーニトロー4-(2 'ーフェニルエチルアミノ)ー2H-1ーベンゾピランー3ーオール(10.0 g, 28.0mmol)と5%パラジウムカーボン(AERtype, 1g)のエタノール溶液(200mL)を室温で6時間攪拌した。反応終了後、反応液をセライトろ過、濃縮し、目的物(収率 98 %)を得た.

# 黒色無定形

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.13 (s, 3H), 1.43 (s, 3H), 2.60-3.0 (m, 4H), 2.5-3.5 (br 6H), 3.47 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.51 (d, J= 9.6 Hz, 1H), 6.12 (s, 1H), 6.14 (s, 1H), 7.15-7.50 (m, 5H)

MS (ESI) m / z;  $400[M+1]^+$ , 327 (bp).

[0724]

(8R\*, 9S\*) - 7, 7 - ジメチル - 9 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] - 8, 9 - ジヒドロ - 7H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン <math>- 8 - 3 - オール

【0725】 【化90】

HÑ OH

[0726]

(3R\*, 4S\*)-6, 7-ジアミノ-3, 4-ジヒドロ-2,  $2-ジメチル-4-(2'-フェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール(1.5g, 4.58mmol)のエタノール溶液 <math>(30\,\mathrm{m\,L})$  に室温で40%グリオキサール水溶液( $997\,\mathrm{mg}$ ,  $6.87\,\mathrm{mmol}$ )を加え、室温で30分攪拌した. 反応終了後、酢酸エチルを加え、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した. 得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物(収率74%)を得た.

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$  : 1.26 (s, 3H), 1.56 (s, 3H),1.60 (br s, 1H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 2.90–3.10 (m, 3H), 3.62 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 3.90 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.24–7.40 (m, 5H), 7.42 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.05 (d, J= 1.7 Hz, 1H), 8.72 (d, J= 1.7 Hz, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;350 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;349 [M-1]^{+}$ 

[0727]

(8R\*, 9S\*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 1マレイン酸塩 (8R\*, 9S\*)-7, 7-ジメチル-9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール(1.18g, 3.38 mmol)の酢酸エチル溶液 (22 mL) に室温でマレイン酸 (471mg, 4.06mmol) を加え10分攪拌した.反応終了後、固形物を濾取し、酢酸エチルで洗浄、乾燥し、目的物(61% 収率)を得た.淡灰色結晶

mp.: 176-179℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  : 1.20 (s, 3H), 1.52 (s, 3H),2.90-3.70 (m, 6H), 4.00-4.15 (m, 1H), 4.71 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 6.07 (s, 2H),6.34 (br s, 1H), 7.15-7.45 (m, 5H), 7.43 (s, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.84 (s, 1H),8.88 (s, 1H).

[0728]

合成例60

```
-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
  [0729]
   【化91】
  [0730]
 合成例60は合成例59と同様の方法により合成した。
  [0731]
(3R*, 4S*)-6, 7-ジアミノ-3, 4-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-4-(2 '- (2-1))
フルオロフェニル) エチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール
  [0732]
   【化92】
  [0733]
 (収率 87 %)
黒色無定形物
MS (ESI^{+}) m / z;346 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;380 [M+45]^{+}
  [0734]
-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール
  [0735]
    【化93】
  [0736]
 (収率 25 %)
灰色無定形物
^{1}\text{H-NMR} (CDC13) \delta: 1.26 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.74 (br s, 2H), 2.85-3.15 (m, 4H)
, 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.91 (d, J =10.4 Hz, 1H), 7.00-7.15 (m, 3H), 7.15-7
.35 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.66 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 1
.7 Hz. 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;368 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;412 [M+45]^{+}
  [0737]
 (8 R*, 9S*) - \{[2-(2-7)\nu + 7] + 7\nu\} - 7, 7-5 + 7\nu
 -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール塩酸塩
 (収率 95%)
 無色結晶
 mp.: 265-268℃(分解)
 合成例 6 1
 -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
   [0738]
```

```
【化94】
  [0739]
 合成例61は合成例59と同様の方法により合成した。
  [0740]
(3R^*, 4S^*) - 6, 7 - \Im F \ge J - 3, 4 - \Im F F D - 2, 2 - \Im F F D - 4 - (2 '- (4 - 2))
フルオロフェニル)エチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール
  [0741]
    【化95】
  [0742]
(収率 87 %)
黒色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.13 (s, 3H), 1.45 (s, 3H),1.90 (br s, 4H), 2.75-3.00 (m, 6H)
3.50-3.70 (m, 2H), 6.16 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 7.02 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 7.17 (
t, J = 8.5 Hz, 2H).
  [0743]
-8, 9-3ビドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール
  [0744]
    【化96】
  [0745]
 (収率 23 %)
桃色油状物
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) \delta: 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H), 1.69 (br s, 2H), 2.83 (t, J = 6.9)
Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.64 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 10.4 Hz, 1H),
6.95-7.05 (m, 2H), 7.15-7.25 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.66 (d, J=1
.7 \text{ Hz}, 1\text{H}), 8.73 \text{ (d, } J=1.7 \text{ Hz}, 1\text{H}).
  [0746]
(8R*, 9S*) - \{[2-(4-7\nu + 7-2\nu) x + 7-2\nu] x + 7-2\nu\}
-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
(収率 95 %)
茶色結晶
mp.: 191-197℃ (分解)
  [0747]
合成例 6 2
(8R*, 9S*) - 9 - [(2 - EFD + v - 2 - DED + v) P = J] - 7, 7 - v
メチルー8, 9- ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリンー8-オール
  [0748]
    【化97】
```

[0749]合成例62は合成例59と同様の方法により合成した。 [0750]  $(3R*, 4S*) - 6, 7 - \Im r \ge J - 3, 4 - \Im \iota \iota \iota \iota \iota \iota - 2, 2 - \Im \iota \iota \iota \iota + I - 4 - (2 '-r) \ge I$ ノー1'ーフェニルエチルー1-ヒドロキシ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール [0751]【化98】 [0752](収率 92%) 分離不能2種ジアステレオマー 黒色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.16 (s, 3H), 1.43 (s, 3H), 2.31 (br s, 7H), 2.70-3.05 (m, 3H) 3.50-3.70 (m, 2H), 4.70-4.80 (m, 1H), 6.16(s, 1H), 6.53 (s, 0.5H), 6.58 (s, 0.5H) 5H), 7.20-7.40 (s, 5H). (8R\*, 9S\*) - 9 - [(2 - EFD + v - 2 - DED + v) P = J] - 7, 7 - vメチルー8、9-ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー8-オール (収率 66%) [0753]分離不能2種ジアステレオマー 灰色無定形物 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 1.30 (s, 3H), 1.58 (s,1.5H), 1.59 (s, 1.5H), 1.70 (br s, 3H), 2.90-3.10 (m, 2H), 3.71 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.95-4.05 (m, 1H), 7.20-7.45 (m, 6H) , 8.10 (s, 0.5H), 8.12 (s, 0.5H), 8.64 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H).  $MS (ESI^{+}) m / z;366 [M+1]^{+}$  $MS (ESI^{-}) m / z;410 [M+45]^{+}$ [0754]合成例 6 3  $(8R*, 9S*) - 7, 7 - \tilde{y} \times f \times 9 - (2 \times f \times r) - 8, 9 - \tilde{y} \in F \cap 7H$ ーピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8-オール 塩酸塩 [0755] 【化99】 OH HC1 [0756] 合成例63は合成例59と同様の方法により合成した。 [0757] $(3R^*, 4S^*) - 6, 7 - \Im F \ge J - 3, 4 - \Im E F D - 2, 2 - \Im A F D - 4 - \alpha D + D F$ ノー2H-1ーベンゾピランー3ーオール 0758 【化100】 [0759]

茶色無定形物

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ: 0.80-0.90 (m, 3H), 0.99 (s,3H), 1.26 (s, 3H), 1.30-1.50 (m, 5 出証特 2 0 0 5 - 3 0 0 8 8 2 0

(収率 98%)

```
H), 2.20-2.30 (m, 1H), 2.40-2.50 (m, 4H), 3.30-3.60 (m, 4H), 3.90 (br s, 2H), 4.3
4 (br s, 2H), 4.93 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 5.89 (s, 1H), 6.59 (s, 1H).
      [0760]
(8R*, 9S*) - 7, 7 - i j j + i j - (2 j j + i j - 2 j k j + i j - 3 k j + i j - 3 k j + i j - 3 k j + i j - 3 k j + i j - 3 k j + i j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j - 3 k j
-ピラノ[2, 3-g]ーキノキサリン-8ーオール
     [0761]
          【化101】
   нй∕~
      [0762]
(収率 36%)
橙色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 0.90 (t, J =7.4 Hz, 3H), 1.32 (s, 3H), 1.20-1.40 (m, 3H), 1.60
-1.70 (m, 3H), 1.61 (s, 3H), 1.81 (brs, 2H), 2.60-2.90 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.
2Hz, 1H), 3.93 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.66 (d, J = 1.9
 Hz, 1H), 8.74(d, J = 1.9 Hz, 1H).
      [0763]
(8R*, 9S*) - 7, 7 - \emptyset + 0
-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
(収率 96%)
淡黄色結晶
mp.: 209-212℃ (分解)
MS (ESI^{+}) m / z;316 [M+1]^{+}
      [0764]
合成例 6 4
]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩
      [0765]
          【化102】
      [0766]
    合成例64は合成例59と同様の方法により合成した。
      [0767]
[0768]
          【化103】
     HN∕~Ph
      [0769]
  (収率 80%)
 白色無定形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.24 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 2.68 (s, 6H), 2.84 (t, J = 6.9 Hz,
  2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.59 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.86 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.
20-7.40 (m, 6H), 7.82 (s, 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;378 [M+1]^{+}
MS (ESI^{-}) m / z;380 [M+45]^{+}
      [0770]
合成例 6 5
```

(8 R\*, 9S\*)-2,3,-ジエチル-7, 7-ジメチル 9-[(2-フェニルエチル) アミノ]-8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール[0771]

【化104】



[0772]

合成例65は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 79%)

白色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.23 (s, 3H), 1.39 (q, J =6.6 Hz, 6H), 1.54 (s, 3H), 2.80-2.9 0 (m, 2H), 2.95-3.10 (m, 10H), 3.60 (d, J =10.4 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m,6H), 7.81 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z;406 [M+1]^{+}$ 

[0773]

合成例 6 6

 $\nu$ ) アミノ] -8 , 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン<math>-8-オール[0774]

【化105】



[0775]

合成例66は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 33%、低極性成分)

白色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC13)  $\delta$ : 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.66 (br s. 2H), 2.72 (s, 3H), 2.8 3 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.15 (m, 4H), 3.61 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.88 (d, J = 10.2 Hz, 1H)  $10.2~\mathrm{Hz},~1\mathrm{H}), 7.15-7.35~(m,~5\mathrm{H}),~7.36~(s,~1\mathrm{H}),~7.50-7.60~(m,~3\mathrm{H}),~7.60-7.70~(m,~2\mathrm{Hz}),~2.50-7.8$ 2H), 7.97 (s,1H).

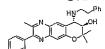
 $MS (ESI^{+}) m / z;440 [M+1]^{+}$ 

[0776]

合成例 6 7

(u) アミノ] (u) 9 (u) 9 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 (u) 7 (u) 9 [0777]

【化106】



[0778]

合成例67は合成例59と同様の方法により合成した。

(収率 29 %、高極性成分)

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.95-3.12 (m, 4H), 3.62 (d, J=10.2 Hz, 1H), 3.91 (d, J=10.2 Hz, 1H), 7.20-7.35 (m, 5H), 7.42 (s,1H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.60-7.70 (m, 2H), 7.90 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;440 [M+1]^{+}$ 

[0779]

合成例 6 8

```
(8R*, 9S*)-2,3,-ジェチャー7, 7-ジメチャ 9-[(2-フェニルエチャ)) ア
[3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] - [3] 
      [0771]
          【化104】
        HŅ∕~_Ph
      [0772]
    合成例65は合成例59と同様の方法により合成した。
  (収率 79%)
白色固形物
^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.23 (s, 3H), 1.39 (q, J =6.6 Hz, 6H), 1.54 (s, 3H), 2.80-2.9
0 \text{ (m, 2H)}, 2.95-3.10 \text{ (m, 10H)}, 3.60 \text{ (d, J = }10.4 \text{ Hz, 1H)}, 3.85 \text{ (d, J = }10.4 \text{ Hz, }1
H), 7.20-7.40 (m, 6H), 7.81 (s, 1H).
MS (ESI^{+}) m / z;406 [M+1]^{+}
      [0773]
合成例 6 6
ル) アミノ] -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール
      [0774]
           【化105】
       [0775]
    合成例66は合成例59と同様の方法により合成した。
   (収率 33%、低極性成分)
 白色無定形物
^{1}H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) \delta: 1.27 (s, 3H), 1.57 (s, 3H),1.66 (br s. 2H), 2.72 (s, 3H), 2.8
3 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.15 (m, 4H), 3.61 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.88 (d, J = 10.2 Hz, 1H)
 10.2 Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 7.36 (s, 1H), 7.50-7.60 (m, 3H), 7.60-7.70 (m,
2H), 7.97 (s,1H).
MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;440 [M+1]^+
       [0776]
合成例 6 7
 ル) アミノ] -8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g] -キノキサリン-8-オール
       [0777]
           【化106】
       [0778]
     合成例67は合成例59と同様の方法により合成した。
   (収率 29 %、高極性成分)
 ^{1}H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) \delta: 1.26 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.86 (t, J = 6.9 Hz,
  2H), 2.95-3.12 (m, 4H), 3.62 (d, J=10.2 Hz, 1H), 3.91 (d, J=10.2 Hz, 1H), 7.
 20-7.35 (m, 5H), 7.42 (s, 1H), 7.45-7.55 (m, 3H), 7.60-7.70 (m, 2H), 7.90 (s, 1H)
```

MS (ESI<sup>+</sup>) m / z;440 [M+1]<sup>+</sup>
[ 0 7 7 9 ]

合成例 6 8

(8R\*, 9S\*) - 3, 7, 7 - hy + hu - 9 - [(2 - y + hu) r + y] - 8, 9-ジヒドロー 7Hーピラノ[2, 3-g]ーキノキサリンー 8-オール1マレイン酸塩 [0780] 【化107】 ОН СООН

[0781]

合成例68は合成例59と同様の方法により合成した。

[0782]

(8R\*, 9S\*)- 3, 7, 7ートリメチル-9-[(2ーフェニルエチル) アミノ]-8 , 9 -ジヒドロー7H-ピラノ[2, 3 - g]ーキノキサリンー8 - オール

[0783]【化108】

 $H\bar{N} { \swarrow}^{bp}$ 

[0784]

(収率 52%)

白色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.25 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.84 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.90-3.10 (m, 4H), 3.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 7.8015-7.40 (m, 6H), 7.89 (s, 1H), 8.54 (s, 1H).

[0785]

(-)フェニルエチルアミノ)-2H-1ーベンゾピラン-3ーオール 1マレイン酸塩

無色結晶

mp.: 189-192℃ (分解)

[0786]

合成例 6 9

8, 9-ジヒドロ-7H-ピラノ[2, 3-g]-キノキサリン-8-オール 塩酸塩

[0787]

【化109】



[0789]【化110】



[0790]

(3 R \* , 4S\* ) -6, 7 ージアミノー3, 4ージヒドロー2, 2ージメチルー 4 ーアミノー2 H-1ーベンゾピランー3ーオール (280mg, 1.25 mmol)のエタノール溶液 (5.6 mL) に室 温で40%グリオキサール水溶液(226mg, 1.56 mmol)を加え、室温で1時間攪拌した. 反応 終了後、1mol/L塩酸を加え、酢酸エチルで洗浄、水相を1mol/L水酸化ナトリウム水溶液で pH 14にし、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した . 得られた混合物をシリカゲルカラム(酢酸エチル/メタノール=10/1)で精製し、目 的物(収率35%)を得た.

淡茶色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.26 (s, 3H), 1.58 (s, 3H), 2.17 (br s, 3H), 3.49 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 7.41 (s,1H), 8.13 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.72 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+}) m / z:246 [M+1]^{+}$ 

[0791]

[0792]

【化111】



[0793]

(8R\*, 9S\*) - 9-アミノ - 7 - 7 - 5

#### 黄色油状物

<sup>1</sup> H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 0.80-1.00 (m, 2H), 1.10-1.40(m, 4H), 1.31 (s, 3H), 1.44 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 1.60 (s, 3H), 1.65-1.80(m, 6H), 2.65-2.90 (m, 2H), 3.68 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.93 (d, J= 10.4 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.67 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H).

[0794]

(8 R\*, 9S\*) - 9 - アミノ - 7, 7 - ジメチル - 8, 9 - ジヒドロ - 7 H - ピラノ[2, 3 - g] - キノキサリン - 8 - オール 塩酸塩

(収率 89%)

黄色結晶

mp.: 258-259℃ (分解)

 $MS (ESI^{+}) m / z;356 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z;400[M+45]^{+}$ 

[0795]

合成例70

6, 7-イミダゾリノー3, 4-ジヒドロー2, 2-ジメチルー4-(2 'ーフェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピランー3-オール

[0796]

【化112】



[0797]

6,7-ジアミノ-3,4-ジヒドロ-2,2-ジメチル-4-(2 'ーフェニルエチルアミノ)-2H-1-ベンゾピラン-3-オール(500mg,1.53mmol)のジオキサン溶液(7ml)に4mol/L塩酸/ジオキサン溶液(0.38ml)を加え、室温で15分攪拌した。続いて、クロロギ酸フェニル(0.21ml,1.53mmol)、トリエチルアミン(0.21ml,1.53mmol)を加え、室温で1時間攪拌した。さらに、トリエチルアミン(0.63ml,4.58mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、1mol/L塩酸を加えて、pHe7~8 に調製した後、酢酸エチルで抽出、飽和食塩

水で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(メタノール/クロロホルム=1/20)で精製し、目的物(収率 4%)を得た.

黄色無定形物

 $^{1}$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.15 (s, 3H), 1.30-1.41 (br,1H), 1.45 (s, 3H), 2.71-3.96 (m, 4H), 3.51 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.51 (s, 1H), 7.12-7.48 (m, 7H), 7.76 (s, 1H)

 $MS (ESI^{+}) m / z;354 [M+1]^{+}$ 

[0798]

合成例 7 1

【0799】 【化113】



[0800]

4- (1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ) アニソール

[0801]

【化114】



[0802]

4-メトキシフェノール(15.0 g, 121 mmol)のアセトニトリル(75 mL)溶液に氷冷下、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデセン(23.9 g,157 mmol)を加え0℃で30分攪拌した(溶液1)。2-メチル-3-ブテン-2-オール(11.7 g,139 mmol)のアセトニトリル(75 mL)溶液に氷冷下、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]ウンデセン(23.9g,157 mmol)を加え0℃で30分攪拌し、続いて、無水トリフルオロ酢酸(25.4 g,121 mmol)を加え、0℃で30分攪拌した(溶液2)。溶液1に塩化第一銅(36 mg,0.36 mmol)を加え、続いて溶液2を15分かけて滴下した。滴下終了後室温に昇温し、終夜攪拌した。反応終了後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、溶媒を減圧留去した。残渣に1mol/L塩酸水溶液を加えて、酢酸エチルで抽出、有機相を1mol/L塩酸水溶液で1回、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で2回、飽和食塩水で1回洗浄した。有機相を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去して、そのまま次の反応に用いた。

[0803]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-1-ベンゾピラン

[0804]

【化115】



[0805]

4- (1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ)アニソールの1, 2-ジクロロベンゼン(50 mL)溶液を190℃で2時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/クロロホルム=3/1)で精製し、目的物を赤色油状物として得た(2工程、収率61%)。

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$  : 1.41 (s, 6H), 3.75 (s, 3H),5.64 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.55 (d, J= 2.7 Hz, 1H), 6.64–6.73 (m, 2H)

 $MS (ESI^{+}): 191[M^{+}+1]$ 

[0806]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-7-ニトロ-2H-1-ベンゾピラン [0807] 【化116】



[0808]

6- メトキシー2, 2- ジメチルー2H-1-ベンゾピラン(3.1~g,16.4~mmol)の酢酸(6.2~mL) 及び無水酢酸 (6.2 mL) の混合溶液を氷冷し、硝酸 (1.37mL, 18.0 mmol) を滴下し た後、0℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応液に1mol/L水酸化ナトリウム水溶液を加え 、酢酸エチル(150 mL)で抽出した。有機相を1mol/L水酸化ナトリウム水溶液で2回、飽 和食塩水で1回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した。残渣をカ ラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル=6/1) で精製し、目的物を黄色結晶 として得た(収率79%)。

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.44 (s, 6H), 3.91 (s, 3H),5.85 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.33 (d, J = 9.6 Hz, 1H, 6.69 (s, 1H), 7.34 (s, 1H)

 $MS (ESI^+): 236 [M^++1]$ 

[0809]

-2H-1-ベンゾピラン

[0810]【化117】



[0811]

6-メトキシ-2, 2-ジメチル-7-ニトロ-2H-1-ベンゾピラン(10.0g, 42.5 mmol)のアセトニトリル溶液(300mL)に、室温でN-メチルイミダゾール(0.678mL, 8.50 mmol)、( R,R,S,S)-(Ph,Ph)-香月触媒(880 mg, 0.850mmol)、ヨードソベンゼン(18.7mg, 85.0 mmol )を加え、2時間攪拌した。反応終了後、反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、セラ イト濾過し、酢酸エチルで抽出、有機層を水、塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸 マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エ チル=4/1)で精製し、目的物を黄色結晶として得た。(収率75 %,光学純度 99.7% ee)  $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.26 (s, 3H), 1.58 (s, 3H),3.53 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 7.08 (s, 1H), 7.33 (s, 1H)

MS (ESI): 251 [M<sup>+</sup>]

HPLC:18.6 min (エナンチオマー 24.1min)

HPLC条件: chiralcel OJ-RH, MeCN/MeOH/0.01 M NaClaq. = 1/3/5, 1.0 ml/min, 40℃, 2 56 nm

[0812]

 $(3R^*, 4S^*)$  -6 - メトキシー2, 2 - ジメチルー7 - ニトロー4 - [(2-フェニルエチル) アミ ノ] -3, 4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピランー3ーオール

[0813] 【化118】



[0814]

 $(3R^*, 4R^*)$  -3, 4 - エポキシ-6 - メトキシ-2, 2 - ジメチル-7 - ニトロ-3, 4 - ジヒ ドロー2H-1ーベンゾピラン(2.50g, 9.95 mmol)の1,4ージオキサン(5.0mL)溶液に、 室温で過塩素酸リチウム(1.06g, 9.95 mmol) と4- (フェニルエチル) アミン (1.50mL, 11.9 mmol) を加え、80℃で1時間撹拌した。反応終了後、反応液に飽和塩化アンモニウム 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機相を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去後、残査をカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=6/4)で精製し、目的物を橙色アモルファス状物として得た(定量的)。

 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.15 (s, 3H), 1.47 (s, 3H),2.73-2.95 (m, 4H), 3.60 (d, J = 10 .0 Hz, 1H), 3.68 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 6.78 (s, 1H), 7.21-7.35 (m, 6H)

MS (ESI): 372[M<sup>+</sup>]

[0815]

【0816】 【化119】



[0817]

MS (ESI):  $473 [M^+ + 1]$ 

[0818]

【0819】 【化120】



[0820]

t-ブチル (3R\*,4S\*) -3-ビドロキシ-6-メトキシ-2, 2-ジメチル-7-ニトロ-3、4-ジビドロ-2H-1-ベンゾピラン-4-イル (2-フェニルエチル) カルバメート (1.32g,2.80 mmol) と5%パラジウム-炭素 (132mg)のメタノール (26mL) 溶液を、水素雰囲気下室温で終夜攪拌した。反応終了後、反応液をセライトろ過し、溶媒を留去後、残査をカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/ 酢酸エチル=4/1) で精製し、目的物を得た(収率94%)。

無色固形物

 $MS (ESI^+): 443[M^++1]$ 

[0821]

[0822]

【化121】

[0823]

(3R\*, 4S\*) -7-アミノー3-ヒドロキシー6-メトキシー2, 2-ジメ tーブチル チルー3、4ージヒドロー2H-1-ベンゾピランー4ーイル(2ーフェニルエチル)カルバメ ート(270mg, 0.61 mmol)のテトラヒドロフラン溶液に室温で、トリエチルアミン(128 $\mu$ L , 0.92 mmol)、クロロアセチルクロリド(73μL, 0.92 mmol)を加え、室温で2時間半攪 拌した。反応終了後、エタノール1mL、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチル で抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリ カゲルカラム (ヘキサン/酢酸エチル=5/1) で精製し目的物を得た。(91%収率) 無色油状物

[0824]

2-クロロ-N-[(3R\*, 4S\*)-3, 6-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ) -3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-7-イル]-アセト アミド

[0825] 【化122】

[0826]

キシー6-メトキシー2,2-ジメチルー3、4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピランー4-イ ル] (2-フェニルエチル) -カルバメート(251 mg, 0.48mmol) の塩化メチレン溶液 (5m L) に0℃で3臭化ボラン (1 M塩化メチレン溶液、2.42mL, 2.42 mmol) を加え、2時間 攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、 飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカ ラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し目的物を得た。(70%収率)

淡桃色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.33 (s, 3H),1.44 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.50 (d, J = 9. 6 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.23 (s, 2H), 6.58 (s, 1H), 6.83 (s, 1H), 7.683 (s, 1H)20-7.35 (m, 5H), 8.47 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 405 [M+1]^{+}$ 

MS (ESI<sup>-</sup>) m / z:  $403 [M-1]^+$ 

[0827]

 $(7R*, 8S*) - 7 - E F G + 5 - 6, 6 - 5 \times 5 \times 5 - 8 - (2 - 7 \times 5 \times 5 \times 5)$ -4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアントラセン-3-オ ン

[0828]【化123】

2-クロロ-N-[(3R $^*$ , 4S $^*$ )-3, 6-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-7-イル]-アセ トアミド (120 mg, 0.30 mmol) のメタノール溶液 (1.2mL) に室温で1mol/L水酸化ナトリ ウム水溶液(1.5mL)を加え、4時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液 を加え、酢酸エチルで抽出、1mo1/L水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マ グネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチ ル=1/1)で精製し目的物を得た。(72%収率)

無色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta:1.14$  (s, 3H),1.44 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.47 (d, J = 9.9) Hz, 1H), 3.56 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 4.55 (d, J = 15.4Hz, 1H), 6.27 (s, 1H), 6.68(s, 1H), 7.20-7.35 (m, 5H), 7.74 (s, 1H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 369 [M+1]^{+}$ 

MS (ESI<sup>-</sup>) m / z:  $367 [M-1]^+$ 

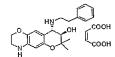
[0830]

合成例 7 2

, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー7-オール マ レイン酸塩

[0831]

【化124】



[0832]

 $(7R*, 8S*) - 7 - \forall F \Box + b - 6, 6 - \forall \forall F \nu - 8 - (2 - \forall T \Box \mu T + \nu T)$ )-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアントラセン-3-オン(42 mg, 0.11 mmol) のテトラヒドロフラン溶液(1.2mL) に室温で水素化リチウムア ルミニウム(1Mテトラヒドロフラン溶液、570µL, 0.57 mmol)を加え、90℃で1.5時間攪 拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食 塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物の酢酸エチル溶液(60  $0\,\mu\,\mathrm{L})$  に室温で、マレイン酸( $13\mathrm{mg},0.11\mathrm{mmol}$ )、ヘキサン $(1\mathrm{mL})$ を加え、室温で15分間攪 拌した。得られた結晶を濾取し、目的物を得た。(60%収率)

淡茶色固形物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ : 1.04 (s, 3H),1.36 (s, 3H), 2.85-3.30 (m, 6H), 3.80-3.85 (m, 1H), 4.11 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 4.15-4.20 (m, 1H), 6.05 (s, 2H), 6.18 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

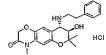
[0833]

合成例 7 3

(7R\*, 8S\*) - 7 - ヒドロキシー4, 6, 6 - トリメチル<math>-8 - (2 - 7 x = 7 x + 7ミノ)-4,6,7,8-テトラヒドロ-1,5-ジオキサ-4-アザーアントラセンー 3ーオン 塩酸塩

[0834]

【化125】



[0835]

t-ブチル (7R\*,8S\*)-[7-ヒドロキシー6,6-ジメチルー3ーオキソー2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5-ジオキサー4-アザーアントラセンー8 -イル](2-フェニルエチル)-カルバメート

[0836]

【化126】

Boch OH

[0837]

 $MS (ESI^{+})m / z: 469 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z: 467 [M-1]^{+}$ 

[0838]

tーブチル (7R\*, 8S\*) -[7-ヒドロキシー4, 6, 6-トリメチルー3ーオキソー2, 3, 4, 6, 7, 8-ヘキサヒドロー1, 5ージオキサー4ーアザーアントラセン-8ーイル] <math>(2-フェニルエチル) -カルバメート

【0839】 【化127】

Bock

[0840]

t-ブチル (7R\*,8S\*)-[7-ヒドロキシー6,6-ジメチルー3-オキソー2,3,4,6,7,8-ヘキサヒドロー1,5-ジオキサー4-アザーアントラセンー8-イル](2-フェニルエチル)-カルバメート(106 mg,0.23 mmol)のジメチルホルムアミド溶液(2 mL)に室温で炭酸カリウム(79mg,0.57 mmol)、ヨウ化メチル(28  $\mu$  L,0.46 mmol)を加え、室温で4時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し目的物を得た。(100%収率)

 $MS (ESI^{+})m / z: 505 [M+23]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z: 527 [M+45]^{+}$ 

[0841]

【0842】 【化128】

O HÃ OH

[0843]

t-ブチル (7R\*,8S\*)-[7-ヒドロキシ-4,6,6-トリメチル-3-オキソ-2,3,4,6,7,8-ヘキサヒドロ-1,5-ジオキサー4-アザーアントラセン-8-イル] <math>(2-フェニルエチル) -カルバメート(115 mg,0.24 mmo1) のエーテル溶液 (2.2 mL) に室温で4mo1/L塩化水素-ジオキサン $(500 \mu L)$ を加え、室温で5時間、50 $^{\circ}$ で30分間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシ

リカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/2)で精製し目的物を得た。(76%収率) 無色油状物

 $^{1}$ H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.17 (s, 3H),1.47 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.29 (s, 3H), 3.49 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.58(d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.52 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 4.58 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 6.42(s, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.20-7.35 (m, 5H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 383 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z: 427 [M+45]^{+}$ 

[0844]

淡桃色固形物

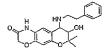
[0845]

合成例 7 4

7-ヒドロキシ-6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-7, 8-ジヒドロ-1 H, 6 H-4, 5-ジオキサ-1-アザーアントラセン-2-オン

[0846]

【化129】



[0847]

4-(1, 1-i)メチルー 2-iロピニルオキシ) -2-iメトキシメトキシー 1-iトローベンゼン

[0848]

【化130】



[0849]

2-ニトロー4-フルオロフェノール(1.6g, 10.2 mmol) のテトラヒドロフラン溶液(32 mL)に室温でクロロメチルメチルエーテル(1.23g, 15.3 mmol)、ジイソプロピルエチルアミン(2.66mL, 15.3 mmol)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物のジメチルアセトアミド溶液(17 mL) に $0^{\circ}$ で水素化ナトリウム(553mg, 12.3 mmol)、1-メチル-2-ブチン-1-オール(1.23mL, 12.7 mmol)を加え、7時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(へキサン/酢酸エチル= 5/1) で精製し目的物を得た。(94%収率)黄色油状物

[0850]

7-メトキシメトキシー2, 2-ジメチルー6-ニトロー2H-1-ベンゾピラン

[0851]

【化131】



#### [0852]

4-(1,1-i)メチルー2-iプロピニルオキシ)-2-iメトキシメトキシー1-iトローベンゼン(2.1~g,7.92mmo1)のジクロロベンゼン溶液(21~mL)を200 $\mathbb C$ で0.5時間攪拌した。反応終了後、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=5/1)で精製し、目的物とその位置異性体の混合物(1:1)を得た。(77%収率)

# 黄色油状物

<sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.46 (s, 6H), 3.53 (s, 1.5 H), 3.58 (s, 1.5H), 5.10 (s, 1H), 5.27 (s, 1H), 5.64 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 5.74 (d, J = 10.4 Hz, 0.5H), 6.60-6.70 (m, 1.5H), 7.67 (s, 0.5H), 7.77 (d, J = 9.1 Hz, 0.5H).

## [0853]

3-  $\overline{)}$   $\overline$ 

[0854]

【化132】



#### [0855]

# 黄色固形物

<sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.45 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 2.73 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.52 (s, 3H), 4.08 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.88 (dd, J = 9.4, 4.4 Hz, 1H), 6.71 (s, 1H), 8.1 6 (s, 1H).

## [0856]

3, 4-xポキシ-7-xトキシメトキシ-2, 2-ジメチル-6-ニトロ-3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン

[0857]

【化133】



#### [0858]

3-プロモー7-メトキシメトキシ 2, 2-ジメチルー6-ニトロー1-ベンゾピランー4-オール(550 mg, 1.52 mmol)のジオキサン溶液(5.5m L)に室温で1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(1.82mL,1.82 mmol)を加え、2時間攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し目的物を得た。(78%収率)

## 黄色油状物

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.32 (s, 3H), 1.59 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.52 (d. J = 3.9 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 8.05 (s, 1H).

#### [0859]

7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-ニトロー 4- ( 2-フェニルエチルアミノ) -3, 4-ジヒドロー2H-1ーベンゾピラン

[0860]

【化134】

[0861]

3, 4-xポキシー7-xトキシメトキシー2,  $2-\tilde{y}$ メチルー6-ニトロー3,  $4-\tilde{y}$ ヒドロー2Hー1ーベンゾピラン(332mg, 1.18 mmol)のジオキサン溶液(1.3 m L)に室温で過塩素酸リチウム(126mg, 1.18 mmol)、フェニルエチルアミン(214mg, 1.77 mmol)を加え、2時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し目的物を得た。(73%収率)淡黄色油状物

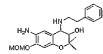
 $^{1}$ H-NMR (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.19 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.45-3.55 (m, 2 H), 3.50 (s, 3H), 5.24 (s, 2H), 6.66 (s, 1H), 7.15-7.40 (m, 5H), 7.72 (s, 1H).

[0862]

7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-アミノー 4- (2-フェニルエチルアミノ) -3 , 4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピラン

[0863]

【化135】



[0864]

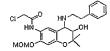
7-メトキシメトキシー 2 , 2-ジメチルー 6-ニトロー 4- (2-フェニルエチルアミノ) -3 , 4-ジヒドロー2H-1-ベンゾピラン (265mg, 0.66mmol) のエタノール溶液 (5mL) に室温で5% パラジウムーカーボン (AER type, 13mg) を加え、水素気流下で一晩攪拌した。反応終了後、セライト濾過、濃縮し目的物を得た。(98%収率) 茶色油状物

 $^{1}\,H-NMR$  (CDC1<sub>3</sub>)  $\delta$  : 1.13 (s, 3H),1.43 (s, 3H), 2.70–3.05 (m, 8H), 3.51 (s, 3H), 3.52–3.60 (m, 2H), 5.12 (s, 2H),6.21 (s, 1H), 6.51 (s, 1H), 7.20–7.50 (m, 5H).

[0865]

[0866]

【化136】



[0867]

7-メトキシメトキシー2, 2-ジメチルー6-アミノー4ー(2-フェニルエチルアミノ)-3, 4-ジヒドロー2H-1ーベンゾピラン(242mg, 0.65 mmol)の酢酸エチルージメチルホルムアミド混合溶液(5 m L)に0℃で4M塩化水素ージオキサン溶液(194 $\mu$ L、0.78 mmol)を加え5分間攪拌した。クロロアセチルクロリド(88 mg, 0.78 mmol)を加え、15分間攪拌した。反応終了後、エタノール、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し目的物を得た。(79%収率)

淡桃色油状物

<sup>1</sup>H-NMR (CDC1<sub>3</sub>) る: 1.17 (s, 3H), 1.45 (s, 3H), 2.75-3.00 (m, 4H), 3.43 (d, J = 9. 出証特 2 0 0 5 - 3 0 0 8 8 2 0

9 Hz, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.59 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.20 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 6.61 (s, 1H), 7.15-7.30 (m, 5H), 8.14 (s, 1H), 8.73 (s, 1H).

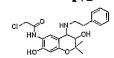
 $MS (ESI^{+}) m / z: 449 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z: 447 [M-1]^{+}$ 

[0868]

2-クロロ-N-[3, 7-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-イル]-アセトアミド

【0869】 【化137】



[0870]

2-クロロ-N-[3-ヒドロキシ-7-メトキシメトキシ-2,2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-イル]-アセトアミド(228 mg, 0.51mmo1) の塩化メチレン溶液(6mL) に0 $^{\circ}$ で三臭化ホウ素(1 M塩化メチレン溶液、2.42mL、2.42 mmo1) を加え、2時間攪拌した。反応終了後、メタノール、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮し目的物を得た。(100%収率)無色無定形物

 $MS^{-}(ESI^{+})m / z: 405 [M+1]^{+}$ 

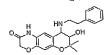
 $MS (ESI^{-}) m / z: 403 [M-1]^{+}$ 

[0871]

7ーヒドロキシー 6, 6-ジメチルー8ー(2-フェニルエチルアミノ)ー 7, 8-ジヒドロー1 H, 6 H - 4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー2-オン

[0872]

【化138】



[0873]

2-クロロ-N-[3, 7-ジヒドロキシ-2, 2-ジメチル-4-(2-フェニルエチルアミノ)-3、4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-イル]-アセトアミド(187 mg, 0.46 mmol) のメタノール溶液(2mL) に室温で1mol/L水酸化ナトリウム水溶液(1.8mL)を加え、3時間攪拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、1mol/L水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(12+サン/酢酸エチル13)で精製し目的物を得た。(13)

無色油状物

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl3)  $\delta$  : 1.14 (s, 3H),1.45 (s, 3H), 2.65-3.00 (m, 4H), 3.53 (d. J = 9.9 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 4.56 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 5.99 (s, 1H), 6.40(s, 1H), 7.15-7.40 (m, 5H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 369 [M+1]^{+}$ 

[0874]

合成例 7 5

6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 7, 8-テトラヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー<math>7-オール マレイン酸塩 【0875】

【化139】

H HN OH COOH

[0876]

【0877】 【化140】



[0878]

7ーヒドロキシー6, 6-ジメチルー8-(2-フェニルエチルアミノ)-7, 8-ジヒドロー1H, 6H-4, 5-ジオキサー1-アザーアントラセンー2ーオン (67mg, 0.18mmol) に室温で水素化リチウムアルミニウム(<math>1 Mテトラヒドロフラン溶液、 $910\mu$ L, 0.91 mmol)を加え、90  $\mathbb C$   $\mathbb C$   $\mathbb C$  で0.5時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮した。得られた混合物をシリカゲルカラム(酢酸エチル)で精製し目的物を得た。(59%収率)

 $^{1}\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ : 1.13 (s, 3H),1.43 (s, 3H), 2.75–3.00 (m, 4H), 3.30–3.35 (m, 2 H), 3.50–3.70 (m, 2H),4.15–4.25 (m, 2H), 6.12 (s, 1H). 6.25 (s, 1H), 7.20–7.35 (m, 5H).

 $MS (ESI^{+})m / z: 355 [M+1]^{+}$ 

 $MS (ESI^{-}) m / z: 389 [M+45]^{+}$ 

[0879]

6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 7, 8-テトラヒドロー 1 H, 6 H-4, 5-ジオキサ-1-アザーアントラセン-7-オール マレイン酸塩 6, 6-ジメチル-8-(2-フェニルエチルアミノ)-2, 3, 7, 8-テトラヒドロ-1 H, 6 H-4, 5-ジオキサ-1-アザーアントラセン-7-オール(36 mg, 0.10 m mol) の酢酸エチル溶液( $800\,\mu$ L)に室温でマレイン酸(14 mg, 0.12mmol)を加え、10分間攪拌した。ヘキサン(1 mL)を加え、0℃で30分間攪拌した。得られた結晶を濾取し、目的物を得た。(73%収率)

淡灰色結晶

mp: 160-162℃ (分解)

 $^{1}\text{H-NMR}$  (DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ : 1.04 (s, 3H),1.36 (s, 3H), 2.85-3.30 (m, 6H), 3.80-3.85 (m, 1H), 4.11 (d, J = 4.2 Hz, 2H),4.15-4.20 (m, 1H), 6.05 (s, 2H), 6.18 (s, 1H), 6. (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

[0880]

合成例 7 6

 $(3R*, 4S*)-4-\{[2-(4-フルオロフェニル)エチル]アミノ\}-7-ヒドロキシメチル-2, 2, 9-トリメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール$ 

【0881】 【化141】

合成例18の方法を準拠して合成した。(収率42%)

白色結晶

mp.; 147-152℃

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDCl}_{3})$ ; 1.26(s, 3H), 1.56(s, 3H), 2.59(s, 3H),2.84-2.86(m, 2H), 2.92-3.09 (m, 2H), 3.64(d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.89(d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.83(s, 2H), 6.99-7.05(m, 3H), 7.12-7.23(m, 2H), 7.29(s, 1H),7.81(s, 1H)

MS(ESI+)m/z; 411 [M+1]+

MS(ESI-)m/z; 455 [M+45]+

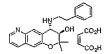
[0883]

合成例77

 $(3R^*, 4S^*)$ -2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1-マレイン酸塩

[0884]

【化142】



[0885]

2,2-ジメチル-2H-ピラノ[2,3-g]キノリン

[0886]

【化143】



[0887]

窒素雰囲気下、6-アミノ-2, 2-ジメチルクロメン(3. 88g, 22. 1mmo1)、 三塩化ルテニウム(55. 0mg, 0. 265mmo1)のジエチレングリコールジメチルエーテル(8mL)溶液に、室温で1, 3-プロパンジオール(0. 639mL, 8. 84mmo1)、トリn-ブチルホスフィン(0. 132mL, 0. 530mmo1)を加え、180℃で5時間攪拌した。反応終了後、フロリジールカラムでルテニウム錯体を除去し、溶媒を留去し、中圧カラムクロマトグラフィー(n+サン/酢酸エチル=5/1)で精製し、目的物(収率59%)を得た。

褐色無定形物

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{CDCl}_{3})$ ; 1.49(s, 6H), 5.91(d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.59(d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.0 8(s, 1H), 7.24-7.28(m, 1H), 7.67(s, 1H), 7.93(d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.70(dd, J = 4.1 Hz, 1.7Hz, 1H)

MS(ESI+)m/z; 212 [M+1]+

[0888]

(3R\*, 4R\*) -3, 4-エポキシ-2, 2-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン

[0889]

【化144】



[0890]

合成例12の方法に準拠して合成した。

[0891]

(収率65%)

CHIRALPAK AD-RH 20mMリン酸緩衝液(pH8.0)/アセトニトリル=60/40 保持時間 7.3分 褐色固体

 $^{1}$ H-NMR(CDCl<sub>3</sub>); 1.30(s, 3H), 1.65(s, 3H), 3.61(d, J= 4.4 Hz, 1H), 4.18(d, J= 4.4 Hz, 1H), 7.17(s, 1H), 7.34 (dd, J= 8.5 Hz, 4.4 Hz, 1H), 8.01(d, J= 7.7 Hz, 1H),

出証特2005-3008820

8.12(s, 1H), 8.79(dd, J= 4.1 Hz, 1.7Hz, 1H) MS(ESI+)m/z; 228 [M+1]+

# [0892]

(3R\*, 4S\*)-2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル) アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]+ノリン-3-オール

[0893]

【化145】



## [0894]

(収率58%)

MS(ESI+)m/z; 349 [M+1]+ MS(ESI-)m/z; 393 [M+45]+

[0895]

 $(3R^*, 4S^*)$ -2, 2-ジメチル-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]-3, 4-ジヒドロ-2H-ピラノ[2, 3-g]キノリン-3-オール 1-マレイン酸塩

(収率79%)

白色結晶

mp.; 187-192℃(分解)

 $^{1}\text{H-NMR}(\text{DMSO-d6})$ ; 1.16(s, 3H), 1.50(s, 3H), 2.94-3.00(m, 1H), 3.09-3.20(m, 2H), 3.34-3.37(m, 1H), 4.07-4.11(m, 1H), 4.69(d, J = 9.4Hz, 1H), 6.05(s, 2H), 6.32(br s, 1H), 7.23-7.39(m, 6H), 7.49(dd, J = 8.3Hz, 4.1 Hz, 1H), 8.22(d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.44(s, 1H), 8.80(d, J = 3.9 Hz, 1H)

[0896]

〔製剤例〕

製剤例1

錠剤

本発明化合物		10 g
乳  糖		260g
微結晶セルロース		600g
コーンスターチ		3 5 0 g
ヒドロキシプロピルセルロー	ス	100g
CMC-Ca		150g
ステアリン酸マグネシウム_		30 g
全 量	1,	500g

上記成分を常法により混合したのち1錠中に1mgの活性成分を含有する糖衣錠10,000錠を製造する。

# [0897]

製剤例2

カプセル剤

本発明化合物		10 g
乳 糖		4 4 0 g
微結晶セルロース	1,	000g
ステアリン酸マグネシウム		50 g
全量		500g

ー 上記成分を常法により混合したのちゼラチンカプセルに充填し、1カプセル中に1mgの活性成分を含有するカプセル剤10,000カプセルを製造する。

[0898]

```
製剤例3
```

軟カプセル剤

本発明化合物 10g PEG400 479g 飽和脂肪酸トリグリセライド 1,500g ハッカ油 1g ポリソルベート(Polysorbate)80 10g 全 量 2,000g

上記成分を混合したのち常法により3号軟ゼラチンカプセルに充填し、1カプセル中に1mgの活性成分を含有する軟カプセル剤10,000カプセルを製造する。

#### [0899]

### 製剤例4

# 軟膏

本発明化合物	1. 0 g
流動パラフィン	10.0g
セタノール	20.0g
白色ワセリン	68.4g
エチルパラベン	0.1g
1ーメントール	0.5g
全 量	100.0g
	- 0/+/一字 1. 1-7

上記成分を常法により混合し、1%軟膏とする。

# [0900]

# 製剤例 5

### 坐剤

本発明化合物 1 g ウィッテップゾールH15\* 4 7 8 g ウィッテップゾールW35\* 5 2 0 g ボリソルベート(Polysorbate)80 1 g 全 量 1,000 g

「\* トリグリセライド系化合物の商標名

ウィッテップゾール=Witepsol」

上記成分を常法により溶融混合し、坐剤コンテナーに注ぎ冷却固化して1mgの活性成分を含有する1g坐剤1,000個を製造する。

#### [0901]

# 製剤例6

#### 注射剤

本発明化合物注射用蒸留水

1 m g 5 m L

用時、溶解して用いる。

# [0902]

### 「薬理試験例〕

有効不応期に及ぼす影響

### 試験方法

ビーグルイヌをペントバルビタールナトリウムにて麻酔し、人工呼吸管理下に正中開胸し心膜切開にて心臓を露出した。心電図測定は、右房自由壁、右心耳、右室自由壁の表面に双極電極を留置して行った。迷走神経刺激は、電気刺激装置を用いて、頸部両側迷走神経内に刺入留置したニクロム線を介して行った。迷走神経への電気刺激の条件は、心電図のRR間隔が刺激開始前より約100msec延長するように設定した。

心房および心室有効不応期は、両側迷走神経刺激下、300msecの基本刺激周期で、プログラム電気刺激装置を用いてS1-S2期外刺激法により測定した。心臓への電気刺激は、閾

値の2倍の電流を用い、基本刺激周期で10回の連続したS1刺激を与えた後、期外刺激S2を加えた。有効不応期測定のため、S1-S2間隔は2 msecずつ短縮していき、期外刺激S2の反応が消失した点を有効不応期とした。

評価は、薬物投与前に心房および心室有効不応期の測定を行い、その後各化合物は0.3mg/kgあるいは0.6mg/kgの用量で静脈内投与し、その5分後より心房および心室有効不応期の測定を行った。

結果は、心房および心室有効不応期の延長時間として、[薬物投与後の有効不応期]ー [薬物投与前の有効不応期] (msec)で表した。

[0903]

結果

[0904]

【表255】

実施例番号	投与量 (mg/kg)	心房不応期 (msec)	実施例番号	投与量 (mg/kg)	心房不応期 (msec)
2	0.6	2 1	4 7	0.3	24
4	0 · 6	30	48	0.3	23
6	0.6	2 0	5 2	о. з	28
7	0.6	25	53	0.3	30
8	0.6	23	58	0.3	28
14	o. 3	2 7	5 9	0.3	2 2
18	о. з	2 7	60	0.3	2 2
19	0.3	2 6	6 1	О. З	2 0
23	0.3	22	63	0.3	23
24	0.3	23	6 9	0.3	37
25	0.3	2 7	7 1	О. З	31
26	О. З	24	73	0.3	31
2 7	0.3	32	74	0.6	2 5
41	0.3	31	7 7	0.3	2 5

# 【産業上の利用可能性】

[0905]

本発明化合物は、心房に選択的な有効不応期延長作用を示すため、抗心房細動薬および 上室性不整脈治療薬として用いることができ、医薬品として有用である。また、本発明化 合物は、心室への影響が小さいことから、上記不整脈病態の安全な治療に貢献できる。 【書類名】要約書

【要約】

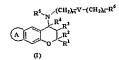
【課題】

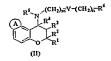
不整脈治療剤の提供。

【解決手段】

式 (I) 又は (II)

【化1】





〔式中、 $R^1$  及び $R^2$  は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基又は $C_{6-1}$  4 アリール基を意味し、 $R^3$  は、水酸基若しくは $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基を意味するか、又は $R^4$  と一緒になって結合を意味し、 $R^4$  は水素原子を意味するか、又は $R^3$  と一緒になって結合を意味し、 $R^4$  は水素原子を意味するか、又は $R^3$  と一緒になって結合を意味し、 $R^4$  は水素原子を意味し、 $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子又は $R^6$  は、水素原子、 $R^6$  は、水素原子、 $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子、 $R^6$  は、水素原子、 $R^6$  は、水素原子、 $R^5$  は、水素原子、 $R^5$  は、水素原子又は $R^5$  は、水素原子のアルキル基、 $R^5$  は、水素原子のアルキルアミノ基、 $R^5$  は、水素原子のアルキルアミノ基、 $R^5$  は、水素原子のアルキルアミノ基、 $R^5$  は、 $R^5$  は、水素原子のアルキルを意味し、 $R^5$  は、 $R^5$  は

【選択図】 なし

特願2004-084605

出願人履歴情報

識別番号

[000003986]

変更年月日
 変更理由]

1990年 8月29日

更理由] 新規登録 住 所 東京都千·

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

氏 名 日産化学工業株式会社